

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 20 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 2.78 (3H, d, J=4.6Hz), 2.92 (6H, s), 3.12-3.19 (2H, m), 3.72 (3H, s), 4.73 (2H, s), 5.28 (1H, t, J=5.8Hz), 5.42 (2H, s), 7.10 (1H, s), 7.15 (1H, s), 7.23 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.37 (1H, q, J=4.6Hz), 8.92 (1H, brs), 9.52 (1H, brs)

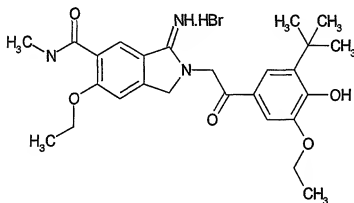
5

MS:m/e (ESI) 480.3 (MH⁺)

実施例 109

2-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10



¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36-1.43 (15H, m), 2.82 (3H, d, J=4.6Hz), 4.12 (2H, q, J=7.0Hz), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.83 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.43 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.6Hz), 8.55 (1H, s).

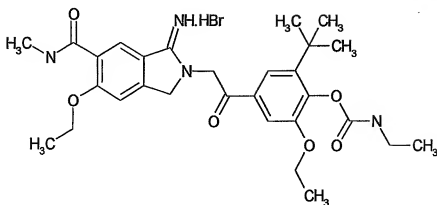
15

MS:m/e (ESI) 468.2 (MH⁺)

実施例 110

エチルカルバミン酸 2-第3ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニ

ル エステル;臭化水素酸塩



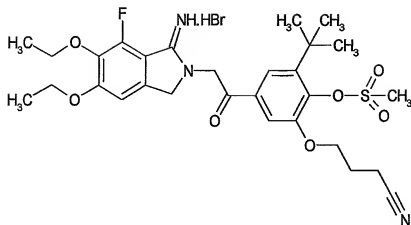
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6) δ :

1. 09 (3H, t, $J=7.0\text{ Hz}$), 1. 31 (3H, t, $J=7.0\text{ Hz}$), 1. 34 (9H, s), 1. 42 (3H, t, $J=7.0\text{ Hz}$), 2. 82 (3H, d, $J=4.8\text{ Hz}$), 3. 05-3. 11 (2H, m), 4. 07 (2H, q, $J=7.0\text{ Hz}$), 4. 28 (2H, q, $J=7.0\text{ Hz}$), 4. 85 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 7. 86 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 8. 21 (1H, q, $J=4.8\text{ Hz}$), 8. 55 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 539. 4 (MH^+)

実施例 111

10 メタン磺酸 2-第 3 プチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩



¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

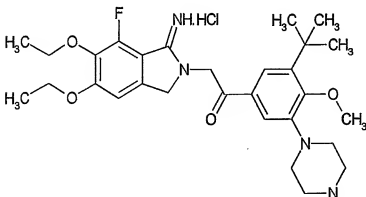
1. 29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 1.44 (9H, s), 2.10-2.17 (2H, m), 2.69 (2H, t, J=7.2Hz), 3.67 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.82 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.63 (1H, s), 7.66 (1H, s), 9.08 (1H, brs), 9.32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 590.2 (MH⁺)

実施例 112

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピペラジン-1-イルフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロインドール-2-イル)-エタノン;2 塩

10 酸塩



¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

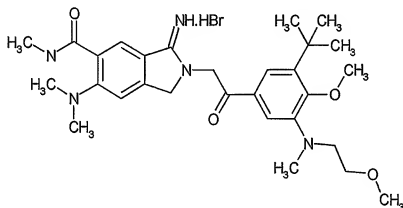
1. 29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 3.21 (4H, brs), 3.32 (4H, br

s), 3.94 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.64 (1H, s), 9.04-9.16 (3H, m), 9.40 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 527.3 (MH⁺)

実施例 113

- 5 2-(2-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシエチル)-メチルアミノ]-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩



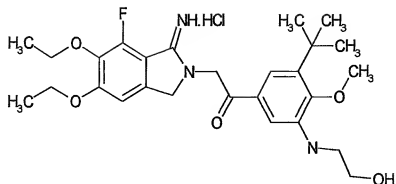
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.36 (9H, s), 2.77 (3H, d, J=4.0Hz), 2.80 (3H, s), 2.91 (6H, s), 3.18 (3H, s), 3.20-3.48 (4H, m), 3.81 (3H, s), 4.73 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.36 (1H, q, J=4.0Hz).

MS:m/e (ESI) 524.3 (MH⁺)

実施例 114

- 15 1-[3-第3ブチル-5-(2-ヒドロキシエチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;塩酸塩



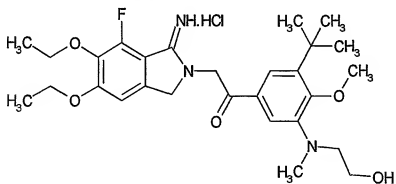
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (3H, t, J=6.8Hz), 1.45 (9H, s), 1.50 (3H, t, J=6.8Hz), 3.44 (2H, t, J=5.4Hz), 3.83 (2H, t, J=5.4Hz), 3.89 (3H, s), 4.18 (2H, q, J=6.8Hz), 4.24 (2H, q, J=6.8Hz), 4.91 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.21 (1H, s), 7.55 (1H, d, J=2.0Hz), 7.66 (1H, d, J=2.0Hz).

MS:m/e (ESI) 502.3 (MH⁺)

実施例 115

1-(3-第 3 ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]-4-メトキシフェニル)-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン; 2 塩酸塩



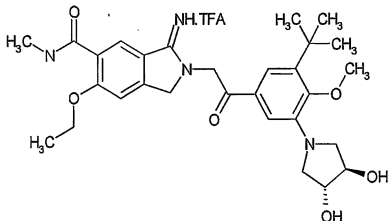
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (3H, t, J=6.8Hz), 1.44 (9H, s), 1.49 (3H, t, J=6.8Hz), 3.04 (3H, brs), 3.38-3.75 (4H, m), 3.95 (3H, s), 5.49 (2H, s), 7.21 (1H, s), 7.77-7.95 (2H, m).

MS:m/e (ESI) 516. 4 (MH⁺)

実施例 116

2-[2-[3-第 3 ブチル-5-(3,4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

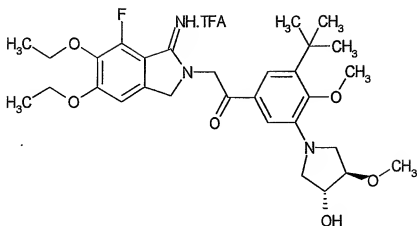


¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 88-2. 95 (2H, m), 3. 50-3. 59 (2H, m), 3. 61 (3H, s), 4. 02 (2H, brs), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 37-5. 60 (2H, m), 7. 29 (1H, s), 7. 38 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 12-8. 28 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 14 (1H, brs), 9. 82 (1H, brs).

実施例 117

1-[3-第 3 ブチル-5-((3R, 4R)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

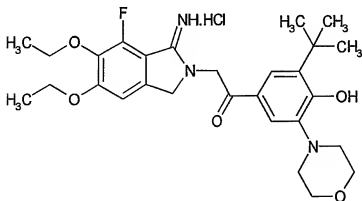


¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7.2 Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=7.2 Hz), 2. 91-2. 99 (1H, m), 3. 03-3. 12 (1H, m), 3. 30 (3H, s), 3. 40-3. 58 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 71-3. 79 (1H, m), 4. 10 (2H, q, J=7.2 Hz), 4. 10-4. 30 (3H, m), 4. 78 (2H, s), 5. 38-5. 60 (2H, m), 7. 30 (1H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 41 (1H, s), 8. 99-9. 12 (1H, m), 9. 20-9. 40 (1H, m).

実施例 118

1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-モルフォリノフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;塩酸塩



¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

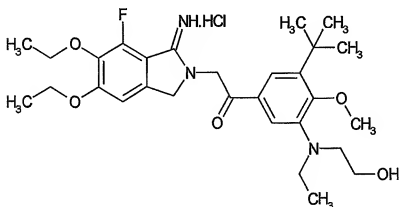
1. 29 (3H, t, J=7.0 Hz), 1. 38-1. 41 (12H, m), 2. 78-2. 79 (4H, m), 3. 81-3. 83 (4H, m), 4. 11

(2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.67 (1H, s), 7.73 (1H, s), 9.03 (1H, brs), 9.20 (1H, brs), 9.28 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 514.3 (MH⁺)

実施例 119

- 5 1-{3-第3ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-4-メトキシフェニル}-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル;塩酸塩

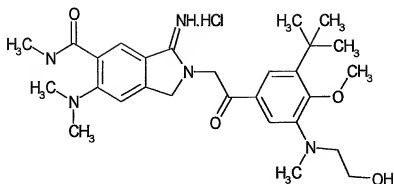


¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 0.96 (3H, t, J=6.4Hz), 1.28 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 3.14-3.26 (4H, m), 3.47 (2H, t, J=6.0Hz), 3.84 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.61 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.60 (1H, s), 9.10 (1H, brs), 9.57 (1H, brs).

実施例 120

- 15 2-(2-{3-第3ブチル-5-[2-ヒドロキシエチル]-メチルアミノ}-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;2塩酸塩



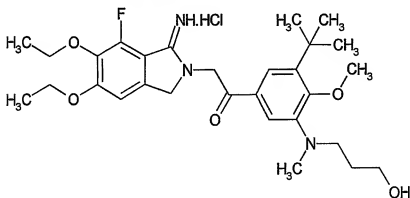
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 2. 75 (3H, d, J=4.0 Hz), 2. 81 (3H, s), 2. 91 (6H, s), 3. 17 (2H, t, J=5.6 Hz), 3. 52 (2H, t, J=5.4 Hz), 4. 73 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 10 (1H, s), 8. 38 (1H, q, J=4.0 Hz), 9. 17 (1H, brs), 9. 65 (1H, brs).

5

実施例 121

1-{3-第3ブチル-5-[(3ヒドロキシプロピル)-メチルアミノ]-4-メトキシフェニル}-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン; 2 塩酸塩



10

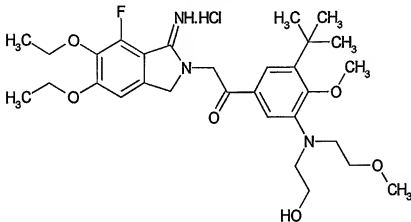
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=6.8 Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6.8 Hz), 1. 61 (2H, t, J=6.4 Hz), 2. 75 (3H, s), 3. 14 (2H, t, J=6.4 Hz), 3. 38 (2H, t, J=6.4 Hz), 3. 82 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6.8 Hz), 4. 20 (2H, q, J=6.8 Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 54 (1

H, s), 9.08 (1H, brs), 9.45 (1H, brs).

実施例 122

1-[3-第3ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)-(2-メトキシエチル)-アミノ]-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 2塩酸塩

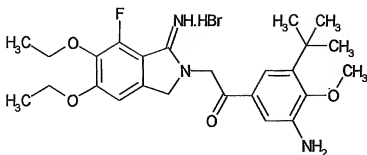


¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=7.2Hz), 3.15 (3H, s), 3.28 (2H, t, J=6.0Hz), 3.20-3.78 (4H, m), 3.46 (2H, t, J=6.0Hz), 3.82 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=7.2Hz), 4.21 (2H, q, J=7.2Hz), 4.79 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.58 (1H, s), 9.06 (1H, brs), 9.39 (1H, brs).

実施例 123

1-(3-アミノ-5-第3ブチル-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩



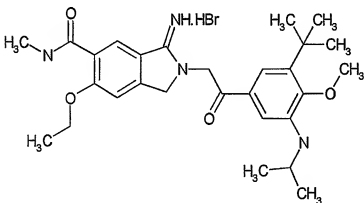
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (3H, t, J=7.2Hz), 1.43 (9H, s), 1.50 (3H, t, J=7.2Hz), 3.85 (3H, s), 4.17 (2H, q, J=7.2Hz), 4.24 (2H, q, J=7.2Hz), 4.82 (2H, s), 5.39 (2H, s), 7.19 (1H, s), 7.44 (1H, d, J=2.0Hz), 7.48 (1H, d, J=2.0Hz).

MS:m/e (ESI) 458.2 (MH⁺)

実施例 124

2-[2-(3-第3ブチル-5-イソプロピルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩



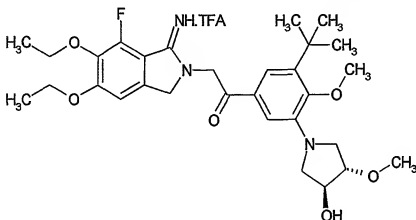
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.19 (6H, d, J=6.0Hz), 1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 3.60-3.78 (1H, m), 3.71 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz), 4.83 (2H, s), 4.90 (1H, d, J=6.0Hz),

5. 46 (2H, s), 7. 14 (1H, s), 7. 22 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 20 (1H, d, J=4. 4Hz), 8. 55 (1H, s).

実施例 125

5 1-[3-第 3 ブチル-5-((3S, 4S)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; トリフルオロ酢酸塩



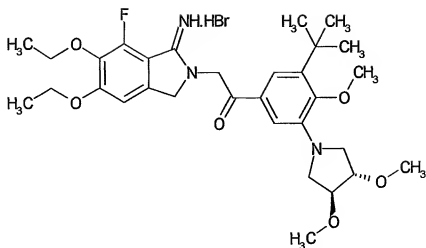
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 91-2. 99 (1H, m), 3. 03-3. 12 (1H, m), 3. 30 (3H, s), 3. 40-3. 58 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 71-3. 79 (1H, m), 4. 10 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 10-4. 30 (3H, m), 4. 78 (2H, s), 5. 38-5. 60 (2H, m), 7. 30 (1H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 41 (1H, s), 8. 99-9. 12 (1H, m), 9. 20-9. 40 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 558. 3 (MH⁺)

実施例 126

15 1-[3-第 3 ブチル-5-((3S, 4S)-3, 4-ジメトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩



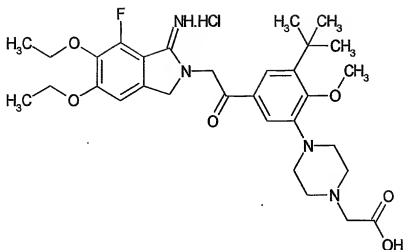
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=7. 2Hz) , 1. 37 (9H, s) , 1. 39 (3H, t, J=7. 2Hz) , 3. 03-3. 16 (2H, m) , 3. 29 (6H, s) , 3. 36-3. 52 (2H, m) , 3. 64 (3H, s) , 3. 91 (2H, brs) , 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz) , 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz) , 4. 78 (2H, s) , 5. 36-5. 62 (2H, m) , 7. 33 (2H, s) , 7. 44 (1H, s) , 8. 95-9. 35 (2H, m) .

MS:m/e (ESI) 572. 4 (MH⁺)

実施例 127

10 (4-(3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペラジン-1-イル)-酢酸; 2 塩酸塩



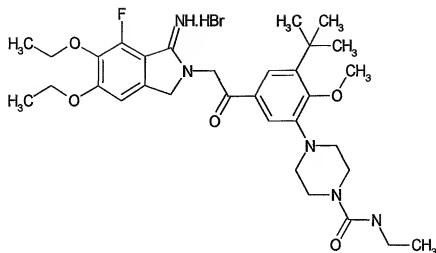
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.38 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 3.10-3.69 (10H, m), 3.93 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.22 (2H, brs), 4.80 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.49 (1H, s), 7.64 (1H, s), 9.10 (1H, brs), 9.40 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 585.3 (MH⁺)

実施例 128

4-{3-[第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール 1-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル]-ピペラジン-1-カルボキシル酸エチルアミド;臭化水素酸塩



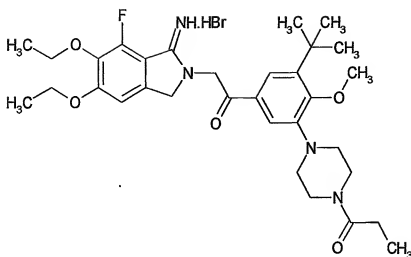
¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 01 (3H, t, J=7. 0Hz) , 1. 30 (3H, t, J=7. 0Hz) , 1. 37 (9H, s) , 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz) , 2. 93
 (4H, brs) , 3. 02-3. 08 (2H, m) , 3. 49 (4H, brs) , 3. 95 (3H, s) , 4. 12 (2H, q, J=7. 0Hz) , 4. 22
 5 (2H, q, J=7. 0Hz) , 4. 79 (2H, s) , 5. 48 (2H, s) , 7. 34 (1H, s) , 7. 50 (1H, s) , 7. 60 (1H, s) .

MS:m/e (ESI) 598. 3 (MH⁺)

実施例 129

1-(4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペラジン-1-イ
 10 ル)-プロパン-1-オン;臭化水素酸塩



¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 00 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 36 (2H, q, J=7. 0Hz), 2. 94 (2H, brs), 2. 98 (2H, brs), 3. 66 (4H, brs), 3. 96 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 50 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 61 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 06 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 583. 4 (MH⁺)

実施例 130

- 1- (3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(1-イミノ-1, 3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 60 (18H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 62-7. 83 (5H, m), 8. 05 (1H, s), 8. 13-8. 22 (1H, m), 9. 21 (1H, brs), 9. 90 (1H, brs).

実施例 131

- 1- (3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(1-イミノ-5-メトキシ-1, 3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 3. 88 (3H, s), 4. 78 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 24 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 35 (1H,

s), 7.77 (2H, s), 8.10 (1H, d, J=8.8Hz), 9.04 (1H, brs), 9.71 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 409.1 (MH⁺)

実施例 132

5 N-{2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (18H, s), 2.10 (3H, s), 4.77 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.59-7.71 (2H, m), 7.76 (2H, s),
8.01-8.12 (1H, s), 8.68 (1H, s), 9.19 (1H, brs), 9.99 (1H, brs), 10.37 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 436.1 (MH⁺)

10 実施例 133

N-{2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-1-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.42 (18H, s), 2.12 (3H, s), 4.81 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.69 (1H, d, J=8.4Hz), 7.77 (2H,
15 s), 8.00-8.20 (3H, m), 9.07 (1H, brs), 9.76 (1H, brs), 10.51 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 436.1 (MH⁺)

実施例 134

20 N-{2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-メタンスルホンアミド;臭化
水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.42 (18H, s), 3.11 (3H, s), 4.80 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.53 (1H, d, J=8.8Hz), 7.73 (1H,
d, J=8.8Hz), 7.75 (2H, s), 8.08 (1H, s), 9.22 (1H, brs), 10.02 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 472.1 (MH⁺)

25 実施例 135

N-{2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-1-イ

ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル)-メタンスルホンアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 3. 16 (3H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 37 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 50 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 10 (1H, d, J=8. 8Hz), 9. 07 (1H, brs), 9. 97 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 472. 1 (MH⁺)

実施例 136

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-6-イソプロポキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 32 (6H, d, J=6. 0Hz), 1. 42 (18H, s), 4. 52-4. 70 (1H, m), 4. 76 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 3 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 64 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 77 (2H, s), 7. 82 (1H, s.), 9. 21 (1H, brs), 9. 78 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 437. 1 (MH⁺)

実施例 137

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-5-イソプロポキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 31 (6H, d, J=6. 0Hz), 1. 42 (18H, s), 4. 68-4. 81 (1H, m), 4. 77 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 1 (1H, d, J=9. 6Hz), 7. 32 (1H, s), 7. 77 (2H, s.), 8. 02-8. 19 (3H, m), 9. 03 (1H, brs), 9. 70 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 437. 2 (MH⁺)

実施例 138

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-6-(2-メトキシ-エトキシ)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 3. 32 (3H, s), 3. 71 (2H, t, J=4. 4Hz), 4. 17 (2H, t, J=4. 4Hz), 4. 77 (2H, s),
5. 51 (2H, s), 7. 40 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 67 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 78 (2H, s), 7. 85 (1H, m), 8
. 08 (1H, brs), 9. 24 (1H, brs), 9. 80 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 453. 2 (MH⁺)

5 実施例 139

1-(3, 5-ジ-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-5-(2-メトキシ-エ
トキシ)-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 3. 30 (3H, s), 3. 66-3. 75 (2H, m), 4. 19-4. 31 (2H, m), 4. 78 (2H, s), 5. 47
10 (2H, s), 7. 24 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 35 (1H, s), 7. 77 (2H, s). 8. 07 (1H, brs), 8. 10 (1H, d, J
=8. 8Hz), 9. 06 (1H, brs), 9. 74 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 453. 1 (MH⁺)

実施例 140

N-{2-[2-(3, 5-ジ-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-1-イ
ミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル]-N-メチル-アセトアミド;臭化水
素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 2. 48 (3H, s), 3. 25 (3H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 66 (1H, d, J=9. 0H
z), 7. 76 (3H, s), 8. 10 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=9. 0Hz), 9. 26 (1H, s), 9. 94 (1H, s).

20 MS:m/e (ESI) 450. 2 (MH⁺)

実施例 141

N-{2-[2-(3, 5-ジ-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イ
ミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル]-N-メチル-アセトアミド;臭化水
素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 2. 48 (3H, s), 3. 25 (3H, brs), 4. 86 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 75-7. 83 (2H, m

), 8.10 (1H, s), 8.16 (1H, s), 9.29 (1H, s), 9.94 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 450.2 (MH⁺)

実施例 142

- 5 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミ
ノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル]-ウレア;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (18H, s), 4.74 (2H, s), 5.49 (2H, s), 6.12 (2H, s), 7.54-7.62 (2H, m), 7.77 (2H, s),
8.08 (1H, s), 8.43 (1H, s), 9.07 (1H, s), 9.21 (1H, s), 9.94 (1H, s).

実施例 143

- 10 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-1-イミ
ノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル]-ウレア;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (18H, s), 4.76 (2H, s), 5.43 (2H, s), 6.19 (2H, s), 7.48 (1H, d, J=7.7Hz), 7.57 (2H,
s), 7.97 (1H, s), 8.0 (1H, d, J=7.7Hz), 8.07 (1H, s), 8.98 (1H, s), 9.22 (1H, s), 9.66 (1H
15 , s).

実施例 144

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-7-イソプロポキシ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.40 (6H, d, J=7.6Hz), 1.42 (18H, s), 4.78 (2H, s), 4.87-5.02 (1H, m), 5.49 (2H, s), 7.2
6 (1H, d, J=8.4Hz), 7.30 (1H, d, J=8.4Hz), 7.82 (1H, t, J=8.4Hz), 7.77 (2H, s), 8.04 (1H
. brs), 8.08 (1H, s), 9.22 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 437.2 (MH⁺)

実施例 145

- 25 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-6-メトキシ-1,3-
ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H. s), 3. 84 (3H. s), 4. 77 (2H. s), 5. 52 (2H. s), 7. 38 (1H. d. J=8. 4Hz), 7. 67 (1H. d. J=8. 4Hz), 7. 78 (2H. s), 7. 86 (1H. s), 8. 08 (1H. brs), 9. 25 (1H. brs), 9. 85 (1H. brs).

MS:m/e (ESI) 409. 1 (MH⁺)

5 実施例 146

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(6-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H. s), 4. 85 (2H. s), 5. 52 (2H. s), 7. 71 (1H. dd. J=8. 8 and 8. 4Hz), 7. 77 (2H. s), 7. 80-7. 88 (1H. m.), 8. 06 (1H. d. J=8. 8Hz).

10

MS:m/e (ESI) 397. 2 (MH⁺)

実施例 147

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(5-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H. s), 4. 86 (2H. s), 5. 51 (2H. s), 7. 52-7. 61 (1H. m.), 7. 69 (1H. d. J=8. 4Hz), 7. 77 (2H. s), 8. 22-8. 31 (1H. m.), 9. 24 (1H. brs), 9. 92 (1H. brs).

MS:m/e (ESI) 397. 1 (MH⁺)

実施例 148

20 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(5-イミノ-5,7-ジヒドロピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;2 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H. s), 4. 91 (2H. s), 5. 58 (2H. s), 7. 75 (1H. dd, J=7. 1, 4. 8Hz), 7. 78 (2H. s), 8. 0 (2H. s), 8. 67 (1H. d, J=7. 1), 8. 94 (1H. d, J=4. 8Hz), 9. 56 (1H. s), 10. 27 (1H. s).

25

MS:m/e (ESI) 380. 1 (MH⁺)

実施例 149

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-[1-イミノ-6-(2-メトキシ-1,1-ジメチル-エトキシ)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 22 (6H. s), 1. 41 (18H. s), 3. 16 (3H. s), 3. 91 (2H. s), 4. 77 (2H. s), 5. 49 (2H. brs), 7. 41 (1H. d. J=8. 0Hz), 7. 67 (1H. d. J=8. 0Hz), 7. 77 (2H. s), 7. 85 (1H. s.), 8. 09 (1H. brs), 9. 22 (1H. brs), 9. 95 (1H. brs).

MS:m/e (ESI) 481. 3 (MH⁺)

実施例 150

- 10 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-[6-(2-ヒドロキシ-1,1-ジメチル-エトキシ)-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 23 (6H. s), 1. 41 (18H. s), 3. 79 (2H. s), 4. 75 (1H. s), 4. 77 (2H. s), 5. 49 (2H. s), 7. 39 (1H. dd. J=8. 4and2. 4Hz), 7. 66 (1H. d. J=8. 4Hz), 7. 77 (2H. s), 7. 83 (1H. brs.), 8. 08 (1H. brs), 9. 21 (1H. brs), 9. 75 (1H. brs).

MS:m/e (ESI) 467. 2 (MH⁺)

実施例 151

- 20 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(1-イミノ-6-イソプロトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 00 (6H. d. J=6. 8Hz), 1. 41 (18H. s), 2. 00-2. 13 (1H. m), 3. 81 (2H. d. J=6. 8Hz), 4. 77 (2H. s), 5. 50 (2H. s), 7. 38 (1H. d. J=8. 8Hz), 7. 65 (1H. d. J=8. 0Hz), 7. 77 (2H. s), 7. 84 (1H. s.), 8. 08 (1H. brs), 9. 22 (1H. brs), 9. 78 (1H. brs).

MS:m/e (ESI) 451. 2 (MH⁺)

実施例 152

2-[2-(3,5-ジ第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩
 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 41 (18H, s), 3. 92 (3H, s), 4. 96 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 7. 92 (1H, d, 8. 0Hz)
 5 , 8. 09 (1H, s), 8. 36 (1H, d, 8. 0Hz), 8. 91 (1H, s), 9. 39 (1H, s), 10. 09 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 437. 1 (MH⁺)

実施例 153

2-[2-(3,5-ジ第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

10 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 41 (18H, s), 4. 92 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 67 (1H, s), 7. 78 (2H, s), 7. 96 (1H, d, J=8. 0H
 z), 8. 09 (1H, s), 8. 20 (1H, s), 8. 25 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 77 (1H, s), 9. 34 (1H, s), 10. 01 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 422. 1 (MH⁺)

15 実施例 154

2-[2-(3,5-ジ第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-1-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 41 (18H, s), 4. 92 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 70 (1H, s), 7. 78 (2H, s), 8. 10 (1H, s), 8. 12 (1H, d, 7. 8Hz), 8. 21 (1H, s), 8. 22 (1H, s), 8. 27 (1H, d, 7. 8Hz), 9. 34 (1H, s), 10. 01 (1H, s)
 20).

MS:m/e (ESI) 422. 2 (MH⁺)

実施例 155

2-(4or5-シアノ-2-イミノ-3-プロピル-ピロリジン-1-イル)-1-(3,5-ジ第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

25

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 40 (18H, s), 4. 98 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 8. 02 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 10 (1H, s), 8. 28 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 67 (1H, s), 9. 48 (1H, s), 10. 06 (1H, s), B: 1. 40 (18H, s), 4. 94 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 8. 10, (1H, s), 8. 18 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 32 (1H, s), 8. 38 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 48 (1H, s), 10. 17 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 404. 1 (MH⁺)

実施例 156

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(6-ヒドロキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 41 (18H, s), 4. 71 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 20 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 48-7. 59 (2H, m), 7. 7 (2H, s), 8. 05 (1H, brs), 9. 12 (1H, brs), 9. 77 (1H, brs), 10. 22 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 395. 1 (MH⁺)

実施例 157

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-ヒドロキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 41 (18H, s), 4. 72 (2H, s), 5. 42 (2H, s), 7. 02 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 07 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 00 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 05 (1H, brs), 8. 93 (1H, brs), 9. 60 (1H, brs), 10. 78 (1H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 395. 1 (MH⁺)

実施例 158

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-6-(2-メトキシ-1-メチル-エトキシ)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 26 (3H, d, J=6. 0Hz), 1. 42 (18H, s), 3. 29 (3H, s), 3. 46-3. 57 (2H, m), 4. 60-4. 68 (1H, m)

, 4. 76 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 37 (1H, dd, J=8. 4 and 2. 4 Hz), 7. 65 (1H, d, J=8. 4 Hz), 7. 78 (2H, s), 7. 87 (1H, brs), 8. 05 (1H, brs), 9. 22 (1H, brs), 9. 79 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 467. 2 (MH⁺)

実施例 159

5 2-[2-(3,5-ジ-第3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 ジメチルアミド;臭化水素酸塩
1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 2. 94 (3H, s), 3. 03 (3H, s), 4. 91 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 7. 84 (1H, d, J=7. 8 Hz), 7. 86 (1H, d, J=7. 8 Hz), 8. 10 (1H, s), 8. 32 (1H, s), 9. 31 (1H, s), 9. 93 (1H, s).

10

MS:m/e (ESI) 450. 2 (MH⁺)

実施例 160

2-[2-(3,5-ジ-第3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸;塩酸塩

15 1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 4. 94 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 7. 90 (1H, d, J=7. 1 Hz), 8. 09 (1H, s), 8. 33 (1H, d, J=7. 1 Hz), 8. 91 (1H, s), 9. 53 (1H, s), 10. 13 (1H, s), 13. 53 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 423. 1 (MH⁺)

実施例 161

20 3-(2-[2-(3,5-ジ-第3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル)-1,1-ジメチル尿素;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 2. 95 (6H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 49 (1H, s), 7. 61 (1H, d, J=7. 9 Hz), 7. 64 (1H, d, J=7. 9 Hz), 7. 77 (2H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 48 (1H, s), 8. 72 (1H, s), 9. 15 (1H, s), 9. 88 (1H, s).

25

MS:m/e (ESI) 465. 2 (MH⁺)

実施例 162

2-(6-第 3 ブチル-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-1-(3,5-ジ-
第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-エタノール;臭化水素酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35 (9H, s), 1. 41 (18H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 69 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 76 (2H, s), 7. 87 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 30 (1H, s), 9. 19 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

実施例 163

10 2-[2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソエチル]-3-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル oxy]-プロパン酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 1. 55 (3H, d, J=6. 8Hz), 4. 75 (2H, s), 4. 90 (1H, q, J=6. 8Hz), 5. 49 (2H, s), 7. 34 (1H, dd, J=8. 8and2. 4Hz), 7. 65 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 73 (1H, brs), 7. 77 (2H, s), 8. 09 (1H, brs), 9. 22 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

15 MS:m/e (ESI) 467. 2 (MH⁺)

実施例 164

2-[2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソエチル]-3-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イルオキシ]-2-メチルプロパン酸;臭
化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 1. 59 (6H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 27 (1H, dd, J=8. 4and2. 4Hz), 7. 65 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 69 (1H, d, J=2. 4Hz), 7. 77 (2H, s), 8. 08 (1H, brs), 9. 17 (1H, s), 9. 93 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 481. 2 (MH⁺)

25 実施例 165

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(1-イミノ-6-メチル-1,3-ジ

ヒドロ-ピロロ[3,4-c]ピリジン-2-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 2. 64 (3H, s), 4. 93 (2H, s), 5. 58 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 09 (1H, s), 8. 94 (1H, s), 9. 61 (1H, brs), 10. 27 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 394. 2 (MH⁺)

実施例 166

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジ
ヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

10 1. 41 (18H, s), 2. 67 (3H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 63 (2H, s), 7. 70 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 78 (2H, s), 8. 08 (1H, brs), 8. 16 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 63 (1H, brs), 9. 94 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 394. 1 (MH⁺)

実施例 167

1-(7-第 3 ブチル-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)-2-(1-イミ
ノ-6-イソプロポキシ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水
素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 30-1. 37 (21H, m), 4. 39 (2H, s), 4. 59-4. 71 (1H, m), 4. 77 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 34 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 65 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 72 (1H, s), 7. 80 (1H, s), 7. 82 (1H, s), 9. 25 (1H, brs), 9. 79 (1H, brs).

20

MS:m/e (ESI) 435. 1 (MH⁺)

実施例 168

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(6-エトキシ-1-イミノ-1,3-
ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 38 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 42 (18H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 77 (2H, s), 5. 51 (2H, s),

25

7. 36 (1H, dd, J=8. 4and2. 4Hz), 7. 66 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 78 (2H, s), 7. 84 (1H, brs), 8. 0
8 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 81 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 423. 1 (MH⁺)

実施例 169

5 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 42 (18H, s), 4. 16 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 49 (2H, s),
7. 21 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 33 (1H, s), 7. 78 (2H, s), 8. 05 (1H, s), 8. 12 (1H, d, J=8. 8Hz), 9
10 . 08 (1H, brs), 9. 75 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 423. 2 (MH⁺)

実施例 170

15 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(1-イミノ-4,7-ジイソプロポキシ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 25 (6H, d, J=6. 0Hz), 1. 38 (6H, d, J=6. 0Hz), 1. 42 (18H, s), 4. 64 (1H, qq, J=6. 0Hz, 6. 0
Hz), 4. 69 (2H, s), 4. 87 (1H, qq, J=6. 0Hz, 6. 0Hz), 5. 48 (2H, s), 7. 24 (1H, d, J=9. 2Hz), 7
15 . 38 (1H, d, J=9. 2Hz), 7. 76 (2H, s), 8. 05 (1H, brs).

実施例 171

20 1-{2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-3-メチル-ウレア;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 2. 67 (3H, s), 4. 74 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 55 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 59 (1H,
d, J=8. 4Hz), 7. 77 (2H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 44 (1H, s), 8. 97 (1H, s), 9. 15 (1H, s), 10. 40 (
25 1H, s).

MS:m/e (ESI) 451. 2 (MH⁺)

実施例 172

1-〔2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソエチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル)-酢酸メチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.40 (18H, s), 3.64 (3H, s), 3.88 (2H, s), 4.83 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.70 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.73 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.78 (2H, s), 8.02-8.10 (1H, br), 8.13 (1H, s), 9.94 (1H, s).

実施例 173

1-〔2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソエチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (18H, s), 3.74 (2H, s), 4.83 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.69 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.78 (2H, s), 8.14 (1H, s), 9.94 (1H, s).

実施例 174

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(1-イミノ-4-イソプロポキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

- 15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36-1.50 (24H, m), 4.79 (2H, s), 4.87-4.98 (1H, m), 5.50 (2H, s), 7.26 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.30 (1H, d, J=8.4 Hz), 7.73 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.77 (2H, s), 8.03 (1H, brs), 8.07 (1H, brs), 9.23 (1H, brs).

- 20 実施例 175

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-[1-イミノ-6-(1-メトキシ-1-メチルエチル)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.13 (t, J=6.8 Hz), 1.41 (18H, s), 3.25 (3H, s), 3.66 (s), 4.12 (q, J=6.8 Hz), 5.12 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.78 (2H, s), 7.79 (1H, d, J=6.8 Hz), 7.86 (1H, d, J=6.8 Hz), 8.39 (1H, s)

実施例 176

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソエチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル]-メトキシ酢酸 エチルエステル;
臭化水素酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 13 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 41 (18H, s), 3. 38 (3H, s), 4. 12 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 86 (2H, s),
5. 12 (1H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 78 (2H, m), 7. 79-7. 84 (2H, s), 8. 31 (1H, s).

実施例 177

10 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソエチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル]-3-メチル酪酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 67 (3H, d, J=6.5), 1. 04 (3H, d, J=6.5), 1. 17 (1H, t, J=6.5), 1. 41 (18H, s), 2. 25-2. 36
(1H, m), 4. 82 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 72 (1H, d, J=7.0), 7. 75 (1H, d, J=7.0), 7. 77 (2H, s),
8. 27 (1H, s), 10. 03 (1H, s).

15 MS:m/e (ESI) 479. 4 (MH⁺)

実施例 178

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソエチル]-6-エトキシ-1-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 第3ブチル エステル;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 41 (18H, s), 1. 53 (9H, s), 4. 14 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 80 (2H, s),
5. 53 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 7. 83 (1H, s), 8. 02 (1H, s).

実施例 179

25 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソエチル]-6-エトキシ-1-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 41 (18H, s), 4. 15 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 7. 87 (1H, s), 8. 05 (1H, s), 9. 06 (1H, s), 10. 05 (1H, s).

実施例 180

- 5 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 25-1. 41 (24H, m), 4. 08 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 14 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 71 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 75 (2H, s), 7. 81 (1H, s), 9. 05 (1H, brs), 9. 59 (1H, brs).

- 10 実施例 181

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(4,7-ジフルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

4. 77 (2H, s), 5. 19 (2H, s), 7. 49 (1H, m), 7. 60 (1H, m), 7. 68 (2H, s).

- 15 実施例 182

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[6-(2-ヒドロキシ-1-メチル-エトキシ)-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 25 (3H, d, J=6. 4Hz), 1. 42 (18H, s), 3. 50-3. 63 (2H, m), 4. 42-4. 53 (1H, m), 4. 76 (2H, s), 4. 95 (1H, t, J=5. 6Hz), 5. 50 (2H, s), 7. 36 (1H, brd, J=8. 8Hz), 7. 64 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 78 (2H, s), 7. 84 (1H, brs), 8. 08 (1H, brs), 9. 21 (1H, brs), 9. 78 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 453. 4 (MH⁺).

実施例 183

- 25 2-[2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イルオキシ]-酪酸;トリフルオロ酢酸

塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 02 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 42 (18H, s), 1. 86-2. 10 (2H, m), 4. 68-4. 83 (3H, m), 5. 50 (2H, s), 7. 36 (1H, dd, J=8. 4and0. 8Hz), 7. 67 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 77 (1H, s), 7. 78 (2H, s), 8. 0

5 8 (1H, brs), 9. 25 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 481. 3 (MH⁺)

実施例 184

2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-メトキシ-酢酸;トリフルオロ酢酸

10 塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 3. 38 (3H, s), 4. 83 (2H, s), 4. 99 (1H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 77-7. 83 (2H, m), 7. 78 (2H, s), 8. 07 (1H, br), 8. 32 (1H, s), 9. 29 (1H, brs), 9. 95 (1H, brs).

実施例 185

15 2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸;トリフルオロ酢酸

塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 41 (18H, s), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 75 (2H, s), 8. 49 (1H, s), 9. 16 (1H, br), 9. 78 (1H, br).

20

実施例 186

2-[2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル]-2-メトキシ-プロパン酸;トリフルオロ酢酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 1. 69 (3H, s), 3. 18 (3H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 78 (3H, s), 7. 86 (

1H, d, J=8.0Hz), 8.07 (1H, br), 8.41 (1H, s), 9.32 (1H, s), 9.99 (1H, s).

実施例 187

N-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチル-メタンスルホンア

5 ミド;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.37 (9H, s), 2.66 (3H, s), 3.14 (6H, sX2), 4.05 (2H, s), 5.47-5.62 (2H, m), 7.70 (1H, d, J=8.0Hz), 7.81 (1H, s), 7.97 (1H, s), 8.16 (1H, d, J=8.0Hz), 9.57 (1H, brs), 9.95 (1H, s), 10.01 (1H, s).

10 MS:m/e (ESI) 445.2 (MH⁺)

実施例 188

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ
-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

15 1.40 (18H, s), 2.82 (3H, d, 5.3Hz), 4.91 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.77 (2H, s), 7.85 (1H, d, J=8.1Hz), 8.03-8.12 (1H, br), 8.21 (1H, d, J=8.1Hz), 8.70 (1H, q, J=5.3Hz), 8.74 (1H, s), 10.05 (1H, s).

実施例 189

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-1-イミノ
-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

20

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.40 (18H, s), 2.81 (3H, d, J=5.3Hz), 4.91 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.79 (2H, s), 8.08 (1H, s), 8.09 (1H, d, 8.1Hz), 8.17 (1H, s), 8.31 (1H, d, J=8.1Hz), 8.74 (1H, q, J=5.3), 9.44 (1H, s), 8.74 (1H, s), 10.05 (1H, s), 10.12 (1H, s).

25 実施例 190

2-[2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イ

ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル]-2-メトキシ-プロピオンアミド;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (1H, s), 1. 68 (3H, s), 3. 18 (3H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 34 (1H, brs), 7. 4
5 3 (1H, brs), 7. 74-7. 78 (1H, m), 7. 77 (2H, s), 7. 84 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 34 (1H, s).

実施例 191

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル]-2-メトキシ-N-メチル-プロピオ
ンアミド;臭化水素酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 1. 69 (3H, s), 2. 68 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 18 (3H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 52 (2H,
s), 7. 71-7. 82 (2H, m), 7. 85 (2H, s), 7. 99 (1H, brs), 8. 31 (1H, s).

実施例 192

- 15 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-プロピル-5,7-
ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 93 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 41 (18H, s), 1. 70-1. 83 (2H, m), 2. 89 (2H, t, J=7. 6Hz), 4. 84 (2H,
s), 5. 57 (2H, s), 7. 71 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 77 (2H, s), 8. 08 (1H, s), 8. 17 (1H, d, J=8. 0
Hz), 9. 52 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

- 20 MS:m/e (ESI) 422. 2 (MH⁺)

実施例 193

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ
-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-スルホン酸ジメチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 40 (18H, s), 2. 67 (6H, s), 4. 99 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 06 (1H, d, J=8. 1H
z), 8. 16 (1H, d, J=8. 1Hz), 8. 73 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 486. 2 (MH⁺)

実施例 194

2-{2-[3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 ジメチルアミド;臭化水素酸塩

5

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (18H, s), 2. 95 (3H, s), 3. 03 (3H, s), 3. 15 (6H, s), 4. 92 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 81-7. 88 (3H, m), 7. 97 (1H, s), 8. 32 (1H, s), 9. 39 (1H, s), 9. 95 (1H, s), 10. 04 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 501. 2 (MH⁺)

10 実施例 195

{(2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボニル)-メチル-アミノ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 40 (18H, s), 3. 00 (3H, s), 4. 20 (2H, s), 4. 92 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 77-7. 88 (2H, m), 7. 78 (2H, s), 8. 09 (1H, s), 8. 24-8. 39 (1H, 2s), 9. 39 (1H, br), 9. 93-10. 03 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 494. 3 (MH⁺)

実施例 196

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(4-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 25-1. 53 (21H, m), 4. 37 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 24-7. 31 (2H, m), 7. 68-7. 79 (3H, m), 8. 07 (1H, brs), 8. 32 (1H, brs), 9. 24 (1H, brs).

実施例 197

25 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-4-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 4. 00 (3H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 25 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 29 (1H, d, J=7. 6Hz), 7. 51-7. 78 (3H, m), 8. 06 (1H, brs), 8. 64 (1H, brs), 9. 23 (1H, brs).

実施例 198

- 5 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-1-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 81 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 7. 91 (1H, s), 7. 94 (1H, s), 8. 21-8. 23 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 480. 3 (MH⁺)

実施例 199

- 15 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 42 (18H, s), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 8--4 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 13 (1H, br), 9. 82 (1H, br).

- 20 MS:m/e (ESI) 480. 3 (MH⁺)

実施例 200

- 25 N-(3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル)-N-メチル-メタンスルホンアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (18H, m), 3. 14 (6H, s), 4. 07-4. 15 (4H, m), 4. 72 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 36 (1H, s),

7. 81 (2H, s), 7. 93 (1H, s), 9. 08 (1H, brs), 9. 60 (1H, brs).

実施例 201

2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 エチルアミド;臭化水素酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 15 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 40 (18H, s), 3. 27-3. 45 (2H, m), 4. 93 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 7 (2H, s), 7. 85 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 01-8. 23 (1H, m), 8. 22 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 70 (1H, s), 8. 72 (1H, s), 9. 34 (1H, s), 10. 01 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 450. 3 (MH⁺)

10 実施例 202

[2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル]-カルバミン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 40 (18H, s), 3. 70 (3H, s), 4. 76 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 61 (1H, dd, J=8. 4, 1. 8Hz), 7. 6 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 77 (2H, s), 8. 07 (1H, brs), 8. 49 (1H, brs), 9. 20 (1H, s), 9. 99 (1H, brs), 10. 12 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 452. 3 (MH⁺)

実施例 203

20 [2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-1-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル]-カルバミン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 40 (18H, s), 3. 70 (3H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 63 (1H, dd, J=8. 4, 1. 8Hz), 7. 7 (2H, s), 7. 92 (1H, s), 8. 09 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 06 (1H, brs), 9. 74 (1H, brs), 10. 33 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 452. 3 (MH⁺)

実施例 204

3-[2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル]-2-メチル-アクリル酸 エチルエ
ステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 41 (18H, s), 2. 08 (3H, s), 4. 23 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 88 (2H, s),
5. 22 (2H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 7. 83-7. 91 (2H, m), 8. 32 (1H, s).

実施例 205

10 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(1-イミノ-6-トリフルオロメ
チル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

4. 98 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 8. 04 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 20 (1H, d, J=8. 0z), 8.
69 (s, 1H).

15 実施例 206

3-[2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル]-2,N-ジメチル-アクリルアミド
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 41 (18H, s), 2. 05 (3H, s), 2. 71 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 31 (1H,
s), 7. 76-7. 80 (2H, m), 7. 78 (2H, s), 8. 10 (1H, br), 8. 30 (1H, s).

実施例 207

25 3-[2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル]-2-メチル-アクリルアミド 臭化
水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 2. 05 (3H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 5. 76 (1H, s), 7. 22 (1H, br), 7. 34 (1H, s), 7. 63 (1H, brs), 7. 77 (3H, s), 7. 79 (1H, d, J=5. 2Hz), 8. 24 (1H, s).

実施例 208

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5,6-ジクロロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

4. 53 (2H, s), 5. 66 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 80 (1H, s), 7. 90 (2H, s).

実施例 209

1-(7-第3ブチル-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (6H, s), 1. 34 (9H, s), 2. 67 (3H, s), 4. 39 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 54 (2H, brs), 7. 71 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 712 (1H, s), 7. 79 (1H, s), 8. 16 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 51 (1H, brs), 9. 95 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 392. 2 (MH⁺)

実施例 210

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-メトキシメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 3. 41 (3H, s), 4. 67 (2H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 50-5. 52 (2H, m), 7. 78 (2H, s), 7. 85 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 08 (1H, brs), 8. 29 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 50-9. 52 (1H, m), 9. 99 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 424. 2 (MH⁺)

実施例 211

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メ

チル-5, 7-ジヒ ドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン; 塩酸塩1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 30-1.50 (21H, m), 2.50 (3H, s), 4.21 (2H, q, J=7.2Hz), 4.79 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.7
6 (3H, sX2), 8.06 (1H, s), 9.24 (1H, brs), 9.74 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 438.2 (MH⁺)

実施例 212

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒ ドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-6-(ピペリジン-1-
カルボニル)-1, 3-ジヒ ドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン; 臭化水素酸塩1H-NMR (DMSO-d6) δ :

10 1.30-1.70 (6H, m) 1.40 (18H, s), 3.28 (2H, m), 3.60 (2H, m), 4.88 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7
.79 (2H, s), 7.81 (1H, d, J=8.4Hz), 7.85 (1H, d, J=8.4Hz), 8.09 (1H, brs), 8.27 (1H, s),
9.34 (1H, brs) 9.94 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 490.3 (MH⁺)

実施例 213

15 1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒ ドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジ
ヒ ドロ-ピロロ [3, 4-b] ピラジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.40 (18H, s), 2.72 (3H, s), 4.93 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.77 (2H, s), 8.97 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 395.2 (MH⁺)

20 実施例 214

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒ ドロキシ-フェニル)-2-(2-ジメチルアミノメチル-7-
イミノ-5, 7-ジヒ ドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン; 塩酸塩1H-NMR (DMSO-d6) δ :

25 1.42 (18H, s), 2.88 (6H, s), 4.64 (2H, brs), 4.96 (2H, s), 5.58-5.72 (2H, m), 7.79 (2H, s
) , 7.95-8.05 (1H, m), 8.10 (1H, s), 8.37 (1H, d, J=8.4Hz), 9.79-9.91 (1H, m), 10.03-10
.10 (1H, m), 10.80-10.96 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 437. 2 (MH⁺)

実施例 215

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-イミノ-4-メトキシメチル-3-フェニル-ピロリジン-1-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (1H, s), 2. 64 (3H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 37 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 54-7. 67 (2H, m), 7. 79 (2H, s).

MS:m/e (ESI) 393. 2 (MH⁺)

実施例 216

10 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (18H, s), 2. 32 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 99 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 07 (1H, s), 9. 37 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 452. 2 (MH⁺)

実施例 217

20 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 (2-メトキシ-エチル)-アミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 40 (18H, s), 3. 27 (3H, s), 3. 31 (2H, s), 3. 48 (2H, brs), 4. 91 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 7 (2H, s), 7. 86 (1H, d, J=8. 0), 8. 09 (1H, brs), 8. 23 (1H, d, J=8. 0), 8. 72 (1H, s), 8. 77 (1H, brs), 9. 24 (1H, brs), 10. 03 (1H, brs).

実施例 218

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ

-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 イソプロピルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 18 (6H, d, J=6.9), 1.40 (18H, s), 4.05-4.16 (1H, m), 4.91 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.77 (2H, s), 7.85 (1H, d, J=8.0), 8.08 (1H, s), 8.23 (1H, dd, J=8.0, 1.1Hz), 8.48 (1H, d, J=7.8Hz), 8.68 (1H, s), 9.32 (1H, brs), 10.00 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 464.3 (MH⁺)

実施例 219

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ

- 10 -2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-スルホン酸アミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.40 (18H, s), 4.95 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.64 (2H, s), 7.77 (2H, s), 7.99 (1H, d, J=7.9), 8.09 (1H, brs), 8.23 (1H, d, J=7.9), 8.75 (1H, s), 10.14 (1H, brs).

実施例 220

15 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ

-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-スルホン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.40 (18H, s), 2.47 (3H, s), 4.96 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.72 (1H, q, J=4.6Hz), 7.77 (2H, s), 8.02 (1H, d, J=7.9), 8.09 (1H, brs), 8.17 (1H, dd, J=7.9, 1.2Hz), 8.75 (1H, s), 10.14 (1H, brs).
- 20

実施例 221

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2,5-ジメチル

-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.42 (18H, s), 1.48 (3H, d, J=7.0Hz), 2.67 (3H, s), 5.00 (1H, q, J=7.0Hz), 5.4 (1H, d, J=18.4Hz), 5.6 (1H, d, J=18.4Hz), 7.73 (1H, d, J=8.0Hz), 7.79 (2H, s), 8.05 (1H, s), 8.18

(1H, d, J=8.0Hz), 9.45 (1H, s), 9.93 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 408.2 (MH⁺)

実施例 222

- 5 2-[2-[2-(3,5-ジ第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソエチル]-3-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドル-5-イル]-2-メトキシアセトアミド;臭化
水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (18H, s), 3.33 (3H, s), 4.77 (1H, br), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.39 (1H, brs), 7.
61 (1H, brs), 7.73-7.83 (2H, m), 7.86 (2H, s), 8.27 (1H, s).

- 10 実施例 223

{2-[2-(3,5-ジ第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソエチル]-3-イミ
ノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドル-5-イル}-メトキシ酢酸 ヒドラジド;臭化
水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.41 (18H, s), 4.35 (1H, br), 4.84 (3H, s), 4.86 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.76 (4H, s), 8.27
(1H, s).

実施例 224

1-[3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-(2-メトキシエチル)-フェニル]-2-(7-イミノ
-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.39 (9H, s), 2.67 (3H, s), 2.94 (2H, t, J=6.8Hz), 3.27 (3H, s), 3.55 (2H, t, J=6.8Hz), 4.
.84 (2H, s), 5.46-5.52 (2H, m), 7.65-7.74 (3H, m), 8.15 (1H, d, J=8.0Hz), 9.40 (1H, s),
9.46-9.56 (1H, m), 9.93 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 396.1 (MH⁺)

- 25 実施例 225

3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ

[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-安息香酸 メチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (9H, s), 2. 67 (3H, s), 3. 98 (3H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 58-5. 69 (1H, m), 7. 71 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 05 (1H, s), 8. 17 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 38 (1H, s), 9. 99 (1H, s), 12. 07 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 396. 0 (MH⁺)

実施例 226

2-{2-[3-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-5-(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-1-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 81 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 13 (6H, s), 4. 19 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 79 (1H, s), 7. 94 (2H, s), 8. 04 (1H, s), 8. 25 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 531. 2 (MH⁺)

15 実施例 227

2-{2-[3-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-5-(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 81 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 13 (6H, s), 4. 17 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 80 (1H, s), 7. 92 (1H, s), 8. 19 (1H, br), 8. 56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 531. 2 (MH⁺)

実施例 228

25 2-{2-[3-(アセチル-メチル-アミノ)-5-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル

ボン酸メチルアミド:臭化水素酸塩1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 12 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 10 (3H, s), 4. 18 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 47 (2H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 42 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 82 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 54 (1H, s), 9. 21 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

実施例 229

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[6-(1-ヒドロキシ-プロピル)-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩1H-NMR(DMSO-d6) δ :

0. 94 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 77-1. 84 (2H, m), 4. 74 (1H, t, J=6. 8Hz), 4. 89 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 67-7. 78 (2H, m), 7. 79 (1H, d, J=7. 6Hz), 7. 93 (2H, s), 8. 13 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 439. 2 (MH⁺) 3

実施例 230

2-{6-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-2-メトキシ-プロピオンアミド;塩酸塩1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 41 (18H, s), 1. 81 (3H, s), 3. 16 (3H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 63 (2H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 78 (2H, s), 7. 83 (1H, d, J=7. 2Hz), 8. 08 (1H, s), 8. 27 (1H, d, J=7. 2Hz), 9. 72 (1H, br), 9. 78 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 481. 1 (MH⁺)

実施例 231

N-{3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-N-メチル-アセトアミド;塩酸塩1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 11 (3H, s), 2. 67 (3H, s), 3. 10 (3H, s), 4. 48 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 55 (2

H, s) 7.71 (1H, d, J=8.0Hz), 7.82 (1H, s), 7.92 (1H, s), 8.15 (1H, d, J=8.0Hz), 9.58 (1H, s), 9.95 (1H, s).

実施例 232

- 5 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(5-エトキシ-4-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.39 (3H, t, J=6.9Hz), 1.40 (18H, s), 4.26 (2H, q, J=6.9Hz), 4.91 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.55 (1H, t, J=8.0Hz), 7.77 (2H, s), 8.03 (1H, d, J=8.0Hz), 8.08 (1H, s), 9.22 (1H, s), 9.90 (1H, brs).

- 10 MS:m/e (ESI) 441.2 (MH⁺)

実施例 233

[2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル]-エチルカルバミン酸 メチルエステル; 臭化水素酸塩

- 15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.10 (3H, t, J=6.8Hz), 1.42 (18H, s), 3.62 (3H, s), 3.70 (2H, q, J=6.8Hz), 4.86 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.72 (1H, d, J=8.4Hz), 7.78 (2H, s), 7.79 (1H, d, J=8.4Hz), 8.16 (1H, s).

実施例 234

- 20 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(6ox7-ヒドロキシメチル-1-イミノ-1,3,6,7-テトラヒドロ-5,8-ジオキサ-2-アザ-シクロペンタ[b]ナフタレン-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

3.66 (2H, brs), 4.05-4.16 (2H, m), 4.45 (1H, m), 4.68 (2H, s), 5.15 (1H, t, J=5.0Hz), 5.56 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.26 (1H, s), 7.75 (2H, s), 7.77 (1H, s).

- 25 実施例 235

2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ

-6-メチル-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

2. 29 (3H, s), 2. 86 (3H, d, J=5. 0Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 80 (2H, s), 7. 41 (1H, s), 7. 81 (2H, s), 7. 86 (1H, s).

5

実施例 236

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-[1-イミノ-6-(1-メトキシプロピル)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 90 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 50 (18H, s), 1. 61-1. 75 (2H, m), 3. 23 (3H, s), 4. 25 (1H, t, J=7. 6Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 92 (2H, s), 7. 32 (1H, s), 7. 50 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 70 (1H, d, J=8. 0 Hz), 7. 98 (2H, s), 8. 70 (2H, brs).

10

実施例 237

N-(2-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-エチル)-N-メチルアセトアミド;塩酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 398 (9H, s), 2. 019 (3H, s),
2. 482 (3H, s), 2. 84-2. 92 (1H, m), 2. 96-3. 02 (1H, m), 3. 014 (3H, s), 3. 34-3. 42 (2H, m),
4. 852 (2H, s), 5. 529 (2H, s), 7. 64-7. 78 (3H, m), 8. 155 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 50-9. 60 (2H, m), 9. 90-9. 99 (2H, m).

20

実施例 238

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(2-エトキシ-7-イミノ-5,7-ジヒドロピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 42 (18H, s), 4. 48 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 54 (2H, s),

7. 24 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 77 (2H, s), 8. 13 (1H, d, J=8. 8Hz), 9. 63 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 424. 1 (MH⁺)

実施例 239

5 2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 ジメチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 15 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 40 (18H, s), 2. 78 (3H, s), 3. 00 (3H, s), 4. 22 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 50 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 02 (1H, s), 8. 08 (1H, brs), 9. 67 (1H, brs).

10

MS:m/e (ESI) 494. 2 (MH⁺)

実施例 240

15 3-第 3 ブチル-N-エチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-N-メチル-ベンゼンスルホンアミド; 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 09 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38 (9H, s), 2. 63 (3H, s), 2. 87 (3H, s), 3. 24 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 86 (2H, s), 6. 24 (2H, s), 7. 44 (1H, d, J=8. 2Hz), 7. 82 (1H, d, J=8. 2Hz), 8. 11 (1H, s), 8. 16 (1H, s), 10. 08 (1H, s), 11. 98 (1H, brs).

20

MS:m/e (ESI) 459. 1 (MH⁺)

実施例 241

3-{6-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-2-イル}-2-メチル-アクリル酸 エチルエステル; 臭化水素酸塩

25

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 27 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 41 (18H, s), 2. 34 (3H, s), 4. 23 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 88 (2H, s),

5. 52 (2H, s), 7. 69 (1H, s), 7. 73 (2H, s), 7. 99 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 28 (1H, d, J=8. 4Hz).

MS: m/e (ESI) 492. 3 (MH⁺)

実施例 242

5 2-(2-{3-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-5-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル}-2-オキシ-エチル)-6-エトキシ-1-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 12 (3H, s), 2. 81 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 09 (3H, s), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 47 (2H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 81 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 7. 94 (1H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 21-8. 25 (1H, m).

10

実施例 243

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-フルオロ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 74 (2H, s), 7. 76 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 51 (1H, br), 8. 54 (1H, d, J=5. 2Hz).

実施例 244

20 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 (2-ヒドロキシ-エチル)-アミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 5Hz), 3. 38 (2H, dt, J=6. 2, 6. 1Hz), 3. 55 (2H, dt, J=6. 2, 6. 0Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 5Hz), 4. 83 (1H, t, J=6. 1Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 35 (1H, t, J=6. 0Hz), 8. 67 (1H, s), 9. 84 (1H, brs).

25

MS: m/e (ESI) 510. 3 (MH⁺)

実施例 245

6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸 ジメチルアミド; 臭化水素酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

2.94 (3H, s), 3.05 (3H, s), 4.94 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.75 (2H, s), 7.96 (1H, d, $J=10\text{Hz}$), 8.38 (1H, d, $J=10\text{Hz}$).

実施例 246

10 1-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピロリジン-2-オン; 臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1.380 (9H, s), 1.93-2.03 (2H, m), 2.34-2.40 (2H, m), 2.672 (3H, s), 3.500 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$, 2H), 4.426 (2H, s), 4.865 (2H, s), 5.570 (2H, s), 7.709 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.812 (2H, s), 8.164 (1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 9.951 (1H, s), 10.674 (1H, s).

実施例 247

N-(1-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-エチル)-アセトアミド; 臭化水素酸塩

20 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1.388 (9H, s), 1.473 (3H, d, $J=6.8\text{Hz}$, 3H), 1.880 (2H, m), 2.673 (3H, s), 4.863 (2H, s), 5.08-5.17 (1H, m), 5.46-5.65 (2H, m), 7.712 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.760 (1H, s), 7.813 (1H, s), 8.169 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 8.948 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$).

実施例 248

25 N-(1-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-エチル)-N-メチル-アセト

アミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 362 (9H, s), 1. 577 (3H, d, J=7. 2Hz), 2. 095 (3H, s), 2. 673 (3H, s), 2. 895 (3H, s), 4. 86
6 (2H, s), 5. 54-5. 76 (3H, m), 7. 711 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 806 (1H, s), 7. 924 (1H, s), 8. 1
5 63 (1H, d, J=8.0Hz), 9. 577 (1H, s), 9. 952 (1H, s), 11. 076 (1H, s).

実施例 249

N-{3-第 3 ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2, 4-ジメチル-5, 7-ジヒドロ-ピロ
ロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒ ドロキシ-ベンジル}-N-メチル-アセ
トアミド;塩酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 32-1. 45 (12H, m), 2. 11 (3H, s), 2. 31 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 11 (3H, s), 3. 90-4. 20 (2
HandH₂O), 4. 78 (2H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 59 (2H, s), 7. 81 (1H, s), 7. 93 (1H, s), 9. 61 (1H,
s), 9. 85 (1H, s), 11. 28 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 481. 2 (MH⁺)

- 15 実施例 250

N-{3-第 3 ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2, 4-ジメチル-5, 7-ジヒドロ-ピロ
ロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒ ドロキシ-フェニル}-N-メチル-メタ
ンスルフォンアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 34-1. 42 (12H, m), 2. 32 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 15 (6H, sX₂), 3. 99 (2H, q, J=6. 8Hz), 4
. 83 (1H, s), 5. 50 (1H, s), 7. 81 (1H, s), 7. 96 (1H, s), 9. 42 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs), 10.
03 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 503. 2 (MH⁺)

実施例 251

- 25 1-{3-第 3 ブチル-2-ヒ ドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ
[3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-2-オン;臭化水素酸

塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (9H, s), 2. 11-2. 21 (2H, m), 2. 41-2. 46 (2H, m), 2. 69 (3H, s), 3. 65-3. 71 (2H, m), 4, 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 72 (1H, d, J=8Hz), 7. 74 (1H, s), 7. 78 (1H, s), 8. 17 (1H, d, J=8 Hz).

5

実施例 252

1-(3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル)-ピペリジン-2-オン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 373 (9H, s), 1. 64-1. 78 (4H, m), 2. 34-2. 38 (2H, m), 2. 674 (3H, s), 3. 43-3. 50 (2H, m), 4. 483 (2H, s), 4. 863 (2H, s), 5. 541 (2H, s), 7. 712 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 822 (1H, d, J=2. 0 Hz), 7. 887 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 164 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 940 (1H, s).

10

実施例 253

1-(3,5-ジ第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-ジメチルアミノメチル-3-エトキシ-7-イミノ-4-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノール;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 25 (18H, s), 1. 37 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 19 (6H, s), 2. 26 (3H, s), 3. 58 (2H, s), 4. 00 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 55 (2H, brs), 4. 88-4. 92 (2H, m), 7. 41 (2H, s).

20

MS: m/e (ESI) 495. 3 (MH⁺)

実施例 254

2-((2-(2-(3,5-ジ第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボニル)-アミノ)-エチル]-カルバミン酸 第3ブチル エステル;臭化水素酸塩

25

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35 (9H, s), 1. 40 (18H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 3. 08-3. 40 (2H, m), 3. 60-3. 78 (2H, m)
) 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 6. 85-6. 94 (1H, m), 7. 55 (1H, s), 7. 7
 5 (2H, s), 8. 29 (1H, t, J=5. 2Hz), 8. 59 (1H, s), 9. 83 (1H, brs) .

MS:m/e (ESI) 609. 3 (MH⁺)

5 実施例 255

2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 (2-アミノエチル)-アミド; 2 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 40 (18H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 96 (2H, brt, J=6. 4Hz), 3. 56 (2H, brq, J=6. 4Hz)
 , 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 77 (2H,
 s), 8. 04 (3H, brs), 8. 47 (1H, t, J=5. 6Hz), 8. 65 (1H, s) .

実施例 256

(2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸)-アミノ-酢酸; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 1. 45 (3H, t, J=7. 0Hz), 4. 05 (2H, d, J=5. 4Hz), 4. 33 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 8
 5 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 59 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 07 (2H, s), 8. 61 (1H, t, J=5. 4Hz), 8
 20 . 73 (1H, s), 9. 15 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs) .

MS:m/e (ESI) 524. 2 (MH⁺)

実施例 257

2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 (2-アセチルアミノエチル)-アミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 18-3. 37 (4H, m), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 7. 96 (1H, t, J=5. 5Hz), 8. 07 (1H, brs), 8. 31 (1H, t, J=5. 1Hz), 8. 60 (1H, s), 9. 13 (1H, brs), 9. 82 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 551. 3 (MH⁺)

5 実施例 258

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3,6,7-テトラヒドロ-1H-5,8-ジオキサ-2-アザ-シクロペンタ[b]ナフタレン-6-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 27 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (18H, s), 4. 25 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 36-5. 15 (3H, m), 7. 30 (1H, s), 7. 71 (1H, s), 7. 91 (2H, s).

MS:m/e (ESI) 509. 2 (MH⁺)

実施例 259

15 [3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ビロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル]-メチルカルバミン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (9H, s), 2. 67 (3H, s), 3. 40 (3H, s), 3. 79 (3H, s), 4. 88 (2H, s), 5. 60 (2H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 70 (1H, d, J=8Hz), 7. 80 (1H, s), 7. 15 (1H, d, J=8Hz).

20 実施例 260

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシ-エチル]-1-イミノ-6-メチル-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 2. 42 (3H, s), 2. 78 (3H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 40 (1H, d, J=6. 0Hz).

実施例 261

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-1-イミノ-6-メチル-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸 (2-メトキシ-エチル)-アミド;臭化水素酸塩

- 5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :
 2.42 (3H, s), 3.26 (3H, s), 3.43 (4H, m), 4.82 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.66 (1H, s), 7.76 (2H, s), 8.05 (1H, s), 8.48 (1H, t, $J=6.0\text{Hz}$).

実施例 262

- 10 2-[2-[3-(1-アセチルアミノ-エチル)-5-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :
 1.38 (9H, s), 1.42 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.46 (3H, d, $J=6.4\text{Hz}$), 1.86 (3H, s), 2.82 (3H, d, $J=4.8\text{Hz}$), 4.28 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4.84 (2H, s), 5.06-5.13 (1H, m), 5.36-5.51 (2H, m), 7.52 (1H, s), 7.74 (1H, s), 7.77 (1H, s), 8.19 (1H, br).

- 15

MS:m/e (ESI) 509.2 (MH⁺)

実施例 263

- 20 N-[2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-(2-メトキシ-エチル)-ベンジル]-N-メチル-アセトアミド;臭化水素酸塩

- $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :
 2.11 (3H, s), 2.68 (3H, s), 2.87 (2H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 3.06 (3H, s), 3.22 (3H, s), 3.53 (2H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 4.48 (2H, s), 4.87 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.71 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 7.78 (1H, s), 7.82 (1H, s), 8.17 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$).

- 25 MS:m/e (ESI) 425.1 (MH⁺)

実施例 264

{2-[2-(3,5-ジ第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-カルバミン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 38-1. 42 (2H, m), 3. 70 (3H, s), 4. 19 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 75 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 50 (1H, s), 8. 81 (1H, s), 9. 07 (1H, brs), 9. 79 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 496. 2 (MH⁺)

実施例 265

10 {2-[2-(3,5-ジ第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-エチルカルバミン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 05 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 33 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (18H, s), 3. 26 (3H, s), 3. 43-3. 51 (2H, m), 4. 18 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 18 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 50 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 04 (1H, s), 9. 11 (1H, brs), 9. 64 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 542. 2 (MH⁺)

実施例 266

20 6-[2-(3,5-ジ第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ [3,4-b] ピリジン-2-カルボン酸 エチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 19 (3H, t, J=10Hz), 3. 42 (2H, q, J=10Hz), 4. 99 (2H, s), 5. 38 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 8. 35 (1H, d, J=10Hz), 8. 43 (1H, J=10Hz, 1H), 8. 83 (1H, t, J=10Hz).

実施例 267

3-[6-[2-(3,5-ジ第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ [3,4-b] ピリジン-2-イル]-2-メチルアクリルアミ

ド 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (1H, s), 2. 33 (3H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 61 (2H, s), 7. 27 (1H, brs), 7. 35 (1H, br), 7. 68 (1H, brs), 7. 78 (2H, s), 7. 86 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 27 (1H, d, =8. 4Hz), 9. 71 (1H, br).

5 MS:m/e (ESI) 463. 1 (MH⁺)

実施例 268

3-{6-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒ ドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-7-イ
ミノ-6, 7-ジヒ ドロ-5H-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-2-イル}-2-メチル-プロピオンア
ミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 09 (3H, d, J=6. 4Hz), 1. 42 (18H, s), 2. 83-2. 89 (2H, m), 3. 14-3. 20 (1H, m), 4. 86 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 6. 75 (1H, s), 7. 29 (1H, s), 7. 66 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 77 (2H, s), 8. 07 (1H, br), 8. 17 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 47 (1H, br), 9. 81 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 465. 2 (MH⁺)

15 実施例 269

N-{3-第 3 ブチル-2-ヒ ドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒ ドロ-ピロロ
[3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-N-メチル-メタンスルホンア
ミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 409 (9H, s), 2. 678 (3H, s), 2. 737 (3H, s), 3. 027 (3H, s), 4. 382 (2H, s), 4. 866 (2H, s), 5. 552 (2H, s), 7. 710 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 804 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 814 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 163 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 944 (1H, s).

実施例 270

25 {3-第 3 ブチル-2-ヒ ドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒ ドロ-ピロロ
[3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-メチルカルバミン酸 ベンジル
エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 400 (9H, s), 2. 681 (3H, s), 2. 949 (3H, s), 4. 533 (2H, s), 4. 861 (2H, s), 5. 165 (2H, s), 5. 504 (2H, s), 7. 24-7. 42 (5H, m), 7. 716 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 804 (1H, s), 8. 170 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 952 (1H, s).

5

実施例 271

1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 45 (9H, s), 2. 64 (3H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 60 (2H, s), 7. 73 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 07 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 18 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 52 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 52 (1H, s), 10. 02 (1H, s), 11. 50 (1H, s).

10

実施例 272

1-(3, 5-ジ第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-4-メチル-2-プロピル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン; 塩酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 95 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37-1. 44 (21H, m), 1. 71-1. 82 (2H, m), 2. 32 (3H, s), 2. 83-2. 90 (2H, s), 3. 97 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 08 (1H, s), 9. 41 (1H, brs), 9. 71 (1H, brs).

20

MS:m/e (ESI) 480. 2 (MH⁺)

実施例 273

N-{3-第 3 ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-4-メチル-2-プロピル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシベンジル}-N-メチル-アセトアミド; 塩酸塩

25

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 96 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 65-1. 82 (2H, m), 2. 11 (3H

, s), 2. 32 (3H, s), 2. 81-2. 85 (2H, m), 3. 11 (3H, s), 3. 98 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 48 (2H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 47-5. 56 (2H, m), 7. 81 (1H, s), 7. 92 (1H, s), 9. 46-9. 56 (1H, m), 9. 72 (1H, brs), 11. 29 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 509. 2 (MH⁺)

5 実施例 274

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インソインドール-5-カルボン酸 (2-メトキシ-エチル)-アミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 40 (18H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 3Hz), 3. 30 (3H, s), 3. 49 (4H, brs), 4. 27 (2H, q, J=7. 3Hz) 4. 84 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 26 (1H, brs) 8. 65 (1H, s), 9. 06 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 524. 2 (MH⁺)

実施例 275

15 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インソインドール-5-カルボン酸 (3-メトキシ-プロピル)-アミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 40 (18H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 74 (1H, tt, J=6. 4, 6. 3Hz), 3. 25 (3H, s), 3. 33 (2H, dd, J=6. 3, 5. 7Hz), 3. 61 (2H, t, J=6. 4Hz), 4. 25 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 07 (1H, brs), 8. 25 (1H, t, J=5. 7Hz), 8. 51 (1H, s), 9. 12 (1H, brs), 9. 80 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 538. 3 (MH⁺)

実施例 276

25 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5-プロピル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.80 (3H, t, J=6.4Hz), 1.42 (18H, s), 1.82-1.94 (2H, m), 2.04-2.14 (2H, m), 2.67 (3H, s), 5.03 (1H, q, J=2.8), 5.35 (1H, d, J=18.8Hz), 5.61 (1H, d, 18.8Hz), 7.72 (1H, d, J=8.0Hz), 7.71 (2H, s), 8.16 (1H, d, J=8.0Hz), 9.95 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 436.2 (MH⁺)

実施例 277

2-(2-[3-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-5-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 (2-ヒドロキシ-エチル)-アミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=7.1Hz), 2.12 (3H, s), 3.10 (3H, s), 3.38 (2H, dt, J=5.4, 5.2Hz), 3.54 (2H, dt, J=5.4, 4.9Hz), 4.28 (2H, q, J=7.1Hz), 4.48 (2H, s), 4.83 (1H, t, J=4.9Hz), 4.86 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.56 (1H, s), 7.82 (1H, s), 7.90 (1H, s), 8.46 (1H, t, J=5.2Hz), 8.68 (1H, s), 9.87 (1H, brs).

15 MS:m/e (ESI) 539.2 (MH⁺)

実施例 278

2-(2-[3-(1-アセチル-アミノ-エチル)-5-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 (2-ヒドロキシ-エチル)-アミド;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.39 (9H, s), 1.42-1.48 (6H, m), 1.88 (3H, s), 3.38 (2H, dt, J=5.5, 5.2Hz), 3.54 (2H, dt, J=5.4, 4.9Hz), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.83 (1H, t, J=4.9Hz), 4.85 (2H, s), 5.13 (1H, d, J=7.0, 6.4Hz), 5.40 (1H, d, J=18.0Hz), 5.50 (1H, d, J=18.0Hz), 7.56 (1H, s), 7.75 (1H, s), 7.79 (1H, s), 8.37 (1H, t, J=5.2Hz), 8.67 (1H, s), 8.90 (1H, d, J=6.4Hz), 9.85 (1H, brs).

25 MS:m/e (ESI) 539.2 (MH⁺)

実施例 279

N-(3-第 3 プチル-2-ヒ ドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メトキシメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル)-N-メチル-アセトアミド;塩酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 11 (3H, s), 3. 10 (3H, s), 3. 41 (3H, s), 4. 48 (2H, s), 4. 68 (2H, s), 4. 91 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 82 (1H, s), 7. 85 (1H, d, J=8.0Hz), 7. 91 (1H, s), 8. 29 (1H, d, J=8.0 Hz), 9. 58 (1H, brs), 10. 00 (1H, brs), 11. 29 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 453. 1 (MH⁺)

10 実施例 280

N-(3-第 3 プチル-2-ヒ ドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-プロピル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル)-N-メチル-アセトアミド;塩酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d₆) δ :

15 0. 93 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 72-1. 82 (2H, m), 2. 11 (3H, s), 2. 86-2. 93 (2H, m), 3. 10 (3H, s), 4. 48 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 72 (1H, d, J=8.0Hz), 7. 82 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 8. 17 (1H, d, J=8.0Hz), 9. 60 (1H, brs), 9. 85 (1H, s), 11. 28 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 451. 1 (MH⁺)

実施例 281

20 2-{2-[2-(3,5-ジ-第 3 プチル-4-ヒ ドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-1-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イルオキシ}-プロパン酸;トリフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d₆) δ :

25 1. 41 (18H, s), 1. 53 (3H, d, J=6, 4Hz), 4. 75 (2H, s), 4. 89-4. 98 (1H, m), 5. 45 (2H, s), 7. 16 (1H, d, J=8.8Hz), 7. 22 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 07 (1H, d, J=8.8Hz), 9. 07 (1H, brs), 9. 76 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 467. 2 (MH⁺)

実施例 282

6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸 ジエチルアミド; 臭化

5 水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 06 (3H, t, J=10Hz), 1. 16 (3H, t, J=10Hz), 3. 20 (2H, q, J=10Hz), 3. 49 (2H, q, J=10Hz), 4. 92 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 74 (2H, s), 7. 90 (1H, d, J=10Hz), 8. 37 (1H, d, J=10Hz).

実施例 283

10 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-6-メトキシ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸 メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 2. 81 (3H, d, J=6. 0Hz), 3. 98 (3H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 31 (1H, brs), 8. 59 (1H, s).

実施例 284

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-6-プロポキシ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸 メチルアミド; 臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 98 (3H, t, J=10Hz), 1. 82 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=6. 0Hz), 4. 20 (2H, t, J=10Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 31 (1H, d, J=6. 0Hz), 8. 59 (1H, s).

実施例 285

25 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(1-イミノ-1,3,6,7-テトラヒドロ-5,8-ジオキサ-2-アザ-シクロペンタ[b]ナフタレン-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 32 (3H, d, J=7.2 Hz), 1. 42 (18H, s), 3. 90-3. 98 (1H, m), 4. 30-4. 44 (2H, m), 4. 69 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 19-7. 27 (1H, m), 7. 68-7. 74 (1H, m), 7. 77 (2H, s), 9. 04 (1H, brs), 9. 64 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 451. 1 (MH⁺)

実施例 286

1-(3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル)-アゼパン-2-オン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 370 (9H, s), 1. 46-1. 59 (4H, m), 1. 61-1. 7 (2H, m), 2. 54-2. 60 (2H, m), 2. 674 (3H, s), 3. 54-3. 60 (2H, m), 4. 506 (2H, s), 4. 865 (2H, s), 5. 521 (2H, s), 7. 711 (1H, d, J=8. 0 Hz), 7. 811 (1H, s), 7. 987 (1H, s), 8. 160 (1H, d, J=8. 0 Hz), 9. 920 (1H, s).

実施例 287

6-クロロ-2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 42 (18H, s), 2. 80 (3H, d, J=4. 8 Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 04-8. 12 (1H, br), 8. 29 (1H, s), 8. 59 (1H, q, J=4. 4 Hz), 9. 38 (1H, br), 9. 95 (1H, br).

20 MS:m/e (ESI) 470. 1 (MH⁺)

実施例 288

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-5,7-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 49 (18H, s), 3. 91 (3H, s), 3. 99 (3H, s), 4. 74 (2H, s), 5. 87 (1H, brs), 6. 02 (2H, s), 6. 5

2 (1H, d, J=2Hz), 6.64 (1H, d, J=2Hz), 7.46 (1H, brs), 8.00 (2H, s) 10.75 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 439.0 (MH⁺)

実施例 289

- 5 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (18H, s), 1.41 (3H, t, J=7.5Hz), 4.84 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.54 (1H, s), 7.69 (1H, brs), 7.77 (2H, s), 8.07 (1H, s), 8.63 (1H, s), 9.15 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

- 10 MS:m/e (ESI) 466.1 (MH⁺)

実施例 290

1-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メチルアミノメチル-フェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 2塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.401 (9H, s), 2.582 (3H, t, J=4.8Hz), 2.667 (3H, s), 4.289 (3H, s), 4.869 (2H, s), 5.627 (2H, s), 5.739 (1H, s), 7.705 (1H, d, J=8.0Hz), 7.870 (1H, s), 8.15-8.17 (2H, m), 9.188 (1H, s), 9.959 (1H, s), 10.207 (1H, s).

実施例 291

- 20 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-6-(2-メトキシ-エトキシ)-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

2.84 (3H, d, J=6.0Hz), 3.76 (2H, t, J=10Hz), 4.85 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.56 (1H, s), 7.76 (2H, s), 8.31 (1H, d, J=6.0Hz), 8.59 (1H, s).

- 25 実施例 292

2-(2-[3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(2-オキソ-ピペリジン-1-イルメチル)-フ

フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 64-1. 75 (4H, m), 2. 33-2. 37 (2H, m), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 44-3. 49 (2H, m), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 48 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 82 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 88 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 20 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 20 (1H, br), 9. 83 (1H, br), 11. 55 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 535. 2 (MH⁺)

実施例 293

- 10 2-[2-(3-第3ブチル-5-エチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 16 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 70 (2H, q, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=4. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 70 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 452. 1 (MH⁺)

実施例 294

- 20 1-(3-第3ブチル-5-エチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 15 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 32-1. 46 (12H, m), 2. 31 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 2. 69 (2H, q, J=7. 6Hz), 3. 99 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 70 (1H, s), 9. 32 (1H, brs), 9. 48 (1H, s), 9. 83 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 424. 1 (MH⁺)

実施例 295

1-(3-第3ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル)-ピペリジン-2-オン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.32-1.44 (12H, m), 1.64-1.78 (4H, m), 2.32 (3H, s), 2.32-2.40 (2H, m), 2.58 (3H, s), 3.41-3.50 (2H, m), 3.95-4.02 (2H, m, AcOEt), 4.48 (2H, s), 4.83 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.82 (1H, s), 7.88 (1H, s), 9.41 (1H, brs), 9.85 (1H, brs), 11.56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 507.2 (MH⁺)

実施例 296

- 10 {2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-7-フルオロ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル}-カルバミン酸メチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.34 (3H, t, J=7.2Hz), 1.40 (18H, s), 3.72 (3H, s), 4.25 (2H, q, J=7.2Hz), 4.89 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.76 (2H, s), 8.06 (1H, s), 8.47 (1H, s), 9.28 (1H, s), 9.36 (1H, brs), 10.07 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 514.1 (MH⁺)

実施例 297

- 20 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(4-イミノ-3a,4,6,6a-テトラヒドロ-1H-ピロロ[3,4-d]イミダゾール-5-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.31 (18H, s), 4.54 (2H, s), 5.20 (2H, s), 6.34 (1H, s), 7.66 (2H, s), 7.97 (1H, s), 9.42 (1H, s), 9.65 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 369.0 (MH⁺)

- 25 実施例 298

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ

-6-イソプロポキシ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 38 (6H, d, J=6.0Hz), 2. 83 (3H, d, J=5.0Hz), 4. 83 (2H, s), 4. 86 (1H, m), 5. 46 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 09 (1H, d, J=5.0Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 79 (1H, brs).

実施例 299

6-シクロプロピルメトキシ-2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 41 (2H, bd, J=8.0Hz), 0. 60 (2H, bd, J=8.0Hz), 2. 85 (3H, d, J=5.0Hz), 4. 15 (2H, d, J=8.0Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 09 (1H, d, J=5.0Hz), 8. 5 (1H, s).

実施例 300

- 15 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-3-メトキシメチル-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 2. 61 (3H, s), 3. 43 (3H, s), 4. 63 (3H, s), 4. 85 (3H, s), 5. 58 (3H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 07 (1H, brs), 8. 15 (1H, s), 9. 49-9. 53 (1H, m), 9. 89-9. 93 (1H, m).

- 20 実施例 301

2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 39 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 28, (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4.8Hz), 4. 28 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 70 (1H, s), 8. 17-8. 23 (1H, m), 8. 55

(1H, s).

MS:m/e (ESI) 438. 1 (MH⁺)

実施例 302

5 3-{6-[2-(3, 5-ジ-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-7-イ
ミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-イル}-2-メトキシ-アクリルア
ミド 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (1H, s), 3. 76 (3H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 6. 71 (1H, s), 7. 65 (1H, br), 7. 75
(2H, s), 7. 98 (1H, br), 8. 27 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 29 (1H, d, J=8. 0Hz).

10 MS:m/e (ESI) 479. 1 (MH⁺)

実施例 303

{2-[2-(3-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-
エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-イル}-カルバミン酸 メ
チルエステル;臭化水素酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 25-1. 42 (12H, m), 2. 28 (3H, s), 3. 70 (3H, s), 4. 18 (2H, q, J=6. 8), 4. 74 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 7. 41 (1H, s), 7. 69 (2H, s), 8. 50 (1H, s), 9. 07 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 454. 1 (MH⁺)

実施例 304

20 1-(3, 5-ジ-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ
-1, 3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 44 (18H, s), 3. 08 (6H, s), 4. 70 (2H, s), 5. 42 (2H, s), 6. 92-6. 97 (2H, m), 7. 79 (2H, s),
7. 95 (1H, d, J=9. 6Hz), 8. 05 (1H, s), 8. 77 (1H, s), 9. 42 (1H, s).

25 実施例 305

1-(3-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ

-2, 4-ジメチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 39 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 28 (3H, s), 2. 31 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 99 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 70 (2H, s), 9. 35 (1H, s), 9. 40 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 410. 0 (MH⁺)

実施例 306

- 10 1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 22 (2H, q, J=7. 0 Hz), 4. 77 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 9. 03 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 485. 1 (MH⁺)

- 15 実施例 307

3-{6-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-イル]-2-メトキシ-アクリルアミド 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 41 (18H, s), 3. 74, 3. 76 (3H, each s), 4. 85, 4. 89 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 6. 02, 6. 70 (1H, each s), 7. 25 (1H, br), 7. 43 (1H, br), 7. 56, 7. 72 (1H, each d, J=8. 0Hz and J=8. 4Hz), 7. 74, 7. 75 (2H, each s).

実施例 308

- 25 2-[2-(3-ブromo-5-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;

臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 76 (1H, d, J=2. 4Hz), 8. 05 (1H, 2, J=2. 0Hz), 8. 20 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 18 (1H, br), 9. 84 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 504. 1 (MH⁺)

実施例 309

2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素

酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz) 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 6. 98 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 64-7. 71 (1H, m), 7. 76 (1H, d, J=1. 6, 8. 4Hz), 7. 81 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 18-8. 22 (1H, m), 8. 55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 424. 0 (MH⁺)

実施例 310

2-(2-[3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-[(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-メチル]-フェニル]-2-オキシエチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 44 (9H, s), 1. 45 (3H, t, J=7Hz), 2. 75 (3H, s), 2. 85 (3H, d, J=6Hz), 3. 04 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 3. 39 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 81 (1H, s), 7. 82 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=6Hz), 8. 59 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

実施例 311

3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (9H, s), 2. 68 (3H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 30 (2H, s), 7. 66 (1H, d, J=1Hz), 7. 70 (1H, d, J=8Hz), 7. 81 (1H, d, J=1Hz), 8. 14 (1H, d, J=1Hz).

実施例 312

- 5 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-4,6-ジエトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド:
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 1. 47 (3H, t, J=7Hz), 1. 51 (18H, s), 3. 04 (3H, d, J=5Hz), 4. 13 (2H, q, J=7Hz), 4. 38 (2H, q, J=7Hz), 4. 74 (2H, s), 5. 88 (1H, brs), 5. 96 (1H, q, J=5Hz), 6. 08 (2H, s), 6. 72 (1H, s), 7. 52 (2H, brs), 7. 99 (2H, s).

MS:m/e (ESI) 524. 0 (MH⁺)

実施例 313

- 15 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(4-イミノ-1-メチル-4,6-ジヒドロ-1H-ピロロ[3,4-d]イミダゾール-5-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

3. 79 (3H, s), 4. 71 (2H, s), 5. 38 (2H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 04 (1H, s), 8. 95 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 383. 0 (MH⁺)

20 実施例 314

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(6-イミノ-1-メチル-4,6-ジヒドロ-1H-ピロロ[3,4-d]イミダゾール-5-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 3. 92 (3H, s), 4. 55 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 05 (1H, brs), 8. 17 (1H, s), 9. 06 (1H, brs), 9. 35 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 383. 0 (MH⁺)

実施例 315

1-(3,5-ジ第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-[7-イミノ-3-(1-メトキシエチル)-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (3H, d, J=6.4Hz), 1.42 (18H, s), 2.68 (3H, s), 3.22 (3H, s), 4.74 (1H, q, J=6.4Hz), 4.86 (2H, brs), 5.55 (2H, s), 7.77 (2H, s), 8.16 (1H, s).

実施例 316

10 6-エトキシ-2-[2-(7-ヒドロキシインダン-4-イル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.413 (3H, t, J=6.8Hz), 1.92-2.02 (2H, m), 2.749 (2H, t, J=7.6Hz), 2.826 (3H, d, J=4.8Hz), 4.278 (2H, t, 6.8Hz), 4.823 (2H, s), 5.334 (2H, s), 6.786 (1H, d, J=8.4Hz), 7.516 (1H, s), 7.751 (1H, d, J=8.4Hz), 8.556 (1H, s).

15 実施例 317

1-(8-第3ブチル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.36 (9H, s), 2.69 (3H, s), 2.92 (3H, s), 3.31 (2H, t, J=4.4Hz), 4.36 (2H, t, J=4.4Hz), 4.85 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.19 (1H, d, J=2.0Hz), 7.30 (1H, d, J=2.0Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0Hz), 8.16 (1H, d, J=8.0Hz), 9.75 (2H, s).

実施例 318

25 2-[2-(8-第3ブチル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 92 (3H, s), 3. 33 (2H, t, J=4. 4Hz), 4. 31 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 36 (2H, t, J=4. 4Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 18 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 30 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 55 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 18 (1H, s), 9. 83 (1H, s).

実施例 319

1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-[(2-メトキシエチル)-メチル-アミノ]-フェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (9H, s), 2. 69 (3H, s), 2. 71 (3H, s), 2. 97 (2H, t, J=5. 2Hz), 3. 31 (3H, s), 3. 43 (2H, t, J=5. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 68 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 80 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 17 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 18 (1H, s), 9. 47 (1H, s), 9. 91 (1H, s).

実施例 320

1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[3-エトキシ-7-イミノ-4-メチル-2-(2-メチル-プロベニル)-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 42 (18H, s), 1. 99 (3H, s), 2. 10 (1H, d, J=0. 8Hz), 2. 30 (3H, s), 3. 93 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 6. 53 (1H, brs), 7. 78 (2H, s), 9. 48 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 492. 1 (MH⁺)

実施例 321

1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2, 4-ジメチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34-1. 43 (12H, m), 2. 31 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 99 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 6. 96 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 76 (1H, dd, J=8. 4and2. 0Hz), 7. 81 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 42 (1H, br s), 9. 83 (1H, brs), 10. 62 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 396. 0 (MH⁺)

5 実施例 322

N-{3-第 3 ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-N-メチル-メタンスルホンアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 37-1. 44 (12H, m), 2. 32 (3H, s), 2. 59 (3H, s), 2. 73 (3H, s), 3. 02 (3H, s), 4. 00 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 38 (2H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 80 (2H, s), 9. 26-9. 50 (2H, m), 9. 84 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 517. 1 (MH⁺)

実施例 323

15 2-(6-クロロ-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 4. 25 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 58 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 06 (1H, brs), 8. 33 (1H, s), 9. 17 (1H, brs), 9. 73 (1H, brs).

20 実施例 324

{6-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ [3,4-b]ピリジン-2-イル}-エチル-カルバミン酸 第 3 ブチル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 19 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (18H, s), 1. 48 (9H, s), 4. 02 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 8. 01 (1H, d, J=8. 6Hz), 8. 19 (1H, d, J=8. 6Hz), 9. 68 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 523. 2 (MH⁺)

実施例 325

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(2-エチルアミノ-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

5 1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 17 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (18H, s), 3. 41 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 63 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 6. 84 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 72 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 77 (2H, s), 8. 06 (1H, s), 9. 21 (1H, s), 9. 32 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 423. 1 (MH⁺)

10 実施例 326

6-エトキシ-2-[2-(4-ヒドロキシナフタレン-1-イル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 6. 98-7. 03 (1H, m), 7. 12-7. 18 (1H, m), 7. 51-7. 56 (3H, m), 7. 59-7. 63 (1H, m), 8. 18-8. 27 (1H, m), 8. 36-8. 45 (1H, m), 8. 57 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 417. 9 (MH⁺)

実施例 327

6-エトキシ-3-イミノ-2-(2-オキシ-2-フェニル-エチル)-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

20

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 61 (2H, t, J=7. 6Hz), 7. 74 (1H, t, J=6. 8Hz), 8. 02 (2H, d, J=6. 8Hz), 8. 20 (2H, q, J=6. 8Hz), 8. 57 (1H, s).

25 MS:m/e (ESI) 351. 9 (MH⁺)

実施例 328

6-エトキシ-2-[2-(4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジ
ヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4.4Hz), 4. 28 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 40
5 (2H, s), 6. 93 (2H, d, J=8.8Hz), 7. 52 (1H, s), 7. 89 (2H, d, J=8.8Hz), 8. 19-8. 21 (1H, m),
8. 56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 368. 0 (MH⁺)

実施例 329

3-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
10 ローイソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-プロパン酸 エ
チルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 17 (3H, t, J=7.2Hz) 1. 39 (9H, s) 1. 41 (3H, t, J=7.2Hz) 2. 58 (2H, t, J=6.4Hz) 2. 82 (3H,
d, J=4.8Hz) 2. 96 (2H, t, J=6.4Hz) 4. 06 (2H, q, J=7.2Hz) 4. 28 (2H, q, J=7.2Hz) 4. 82 (2H,
15 s), 7. 52 (1H, s) 7. 70 (1H, s) 7. 72 (1H, s) 8. 18 (1H, q, J=4.8Hz) 8. 54 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 524. 1 (MH⁺)

実施例 330

2-アセチルアミノ-3-{6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オ
20 キソ-エチル]-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-プロ
ピオンアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 1. 86 (3H, s), 3. 09-3. 15 (1H, m), 3. 27-3. 33 (1H, m), 4. 69-4. 73 (1H, m), 4
. 86 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 09 (1H, brs), 7. 38 (1H, brs), 7. 67 (1H, d, J=8.0Hz), 7. 77 (2
H, s), 8. 16-8. 21 (2H, m).

25 MS:m/e (ESI) 508. 1 (MH⁺)

実施例 331

3-(3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル)-プロパン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 17 (3H, t, J=7.2Hz) 1. 38 (9H, s) 2. 58 (2H, t, 6. 4Hz) 2. 68 (3H, s) 2. 95 (2H, t, J=6. 4Hz)
4. 06 (2H, q, J=7. 2Hz) 4. 83 (2H, s) 5. 47 (2H, s) 7. 68-7. 74 (3H, m) 8. 13 (1H, d, J=8. 0Hz).
MS: m/e (ESI) 438. 1 (MH⁺)

実施例 332

- 10 2-[2-(3-シクロヘキシル-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 20-1. 46 (5H, m), 1. 409 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 66-1. 83 (5H, m), 2. 252 (3H, s), 2. 822 (3H, d, J= 4. 8Hz), 2. 91-3. 01 (1H, m), 4. 276 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 836 (2H, s), 5. 425 (2H, s), 7. 526 (1H, s), 7. 639 (2H, s), 8. 18-8. 21 (1H, m), 8. 551 (1H, s).

実施例 333

- 1-(3-シクロヘキシル-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 22-1. 48 (5H, m), 1. 68-1. 85 (5H, m), 2. 262 (3H, s), 2. 680 (3H, s), 2. 93-3. 02 (1H, m), 4. 854 (2H, s), 5. 496 (2H, s), 7. 651 (2H, s), 7. 713 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 159 (1H, d, J=8. 0 Hz).

実施例 334

- 25 2-[2-(3-シクロペンチル-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチル

ルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 409 (3H, t, J=6.8Hz), 1.47-1.82 (6H, m), 1.93-2.03 (2H, m), 2.252 (3H, s), 2.822 (3H, d, J=4.4Hz), 4.276 (2H, q, J=6.8Hz), 4.834 (2H, s), 5.424 (2H, s), 7.524 (1H, s), 7.644 (1H, s), 7.659 (1H, s), 8.17-8.23 (1H, m), 8.549 (1H, s).

実施例 335

1-(3-シクロペンチル-4-ヒドロキシ-5-メチルフェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.46-1.82 (6H, m), 1.93-2.03 (2H, m), 2.252 (3H, s), 2.669 (3H, s), 4.839 (2H, s), 5.479 (2H, s), 7.63-7.68 (2H, m), 7.700 (1H, d, J=8.4Hz), 8.145 (1H, d, J=8.4Hz).

実施例 336

1-(3-シクロペンチル-4-ヒドロキシ-5-メチルフェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.394 (3H, t, J=6.8Hz), 1.47-1.58 (2H, m), 1.60-1.82 (4H, m), 1.94-2.04 (2H, m), 2.250 (3H, s), 2.310 (3H, s), 2.578 (3H, s), 3.988 (2H, q, J=6.8Hz), 4.811 (2H, s), 5.457 (2H, s), 7.645 (1H, s), 7.659 (1H, s).

実施例 337

2-(2-{3-[(2-ベンジルオキシエチル)-メチルアミノ]-5-第3-ブチル-4-ヒドロキシフェニル}-2-オキソエチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.40 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=6.8Hz), 2.71 (3H, s), 2.84 (3H, d, J=4.4Hz), 3.04 (2H, t, J=

5. 2Hz), 3. 55 (2H, t, J=5. 2Hz), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 53 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 20-7. 40 (5H, m), 7. 55 (1H, s), 7. 68 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 80 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 21 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 16 (1H, s), 9. 24 (1H, s), 9. 83 (1H, s).

実施例 338

- 5 2-(2-{3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-フェニル}-2-オキシ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 69 (3H, s), 2. 84 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 86 (2H, t, J=5. 2Hz), 3. 58 (2H, t, J=5. 2Hz), 4. 29 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 65 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 71 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 00-10. 00 (2H, brs).
- 10

実施例 339

- 15 6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-4-メチル-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸
第3ブチル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (3H, t, 6. 8Hz), 1. 42 (18H, s), 1. 58 (9H, s), 2. 37 (3H, s), 4. 08 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 00-8. 12 (1H, m), 9. 42-9. 55 (1H, m), 9. 98 (1H, brs).
- 20

MS:m/e (ESI) 538. 3 (MH⁺)

実施例 340

- 25 6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-4-メチル-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸;
トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (18H, s), 2. 35 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 89 (2H, s),
5. 53 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 02-8. 12 (1H, m), 9. 42-9. 50 (1H, m), 9. 99 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 482. 2 (MH⁺)

実施例 341

- 5 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-チアゾール-2-
イル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 43 (18H, s), 4. 96 (2H, s), 5. 62 (2H, s), 7. 79 (2H, s), 8. 03 (1H, d, J=3. 1Hz), 8. 09 (1H,
d, J=3. 1Hz), 8. 42 (1H, d, J=8. 1Hz), 8. 54 (1H, d, J=8. 1Hz), 9. 90 (1H, brs).

- 10 MS:m/e (ESI) 463. 0 (MH⁺)

実施例 342

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-
3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-スルホン酸メチルアミド;臭
化水素酸塩

- 15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 47 (3H, brs) 4. 35 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 87 (2H, s)
, 5. 49 (2H, s), 7. 15 (1H, q, J=4. 5Hz), 7. 67 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 06 (1H, brs), 8. 73 (1
H, s), 9. 23 (1H, brs), 9. 94 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 516. 2 (MH⁺)

- 20 実施例 343

2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イ
ミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸
塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 93 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=
6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 19 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 84 (1H, d, J=2

. 4Hz), 7.93 (1H, dd, J=2.4, 8.8Hz), 8.17-8.23 (1H, m), 8.56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 438.0 (MH⁺)

実施例 344

5 2-[2-(3-第3ブチル-5-クロロ-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ:

1.39 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.84 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.53 (1H, s), 7.74 (1H, s), 7.93 (1H, s), 8.18-8.22 (1H, m), 8.55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 458.1 (MH⁺)

実施例 345

15 2-[2-[3-第3ブチル-5-(2-ジメチルカルバモイル-エチル)-4-ヒドロキシフェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ:

1.38 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.2Hz), 2.77-2.90 (4H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 2.86 (3H, s), 2.97 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz), 4.84 (2H, s), 5.42 (2H, s), 7.52 (1H, s), 7.69 (1H, s), 7.73 (1H, s), 8.18 (1H, q, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s), 9.16 (1H, brs), 9.8 (1H, brs), 10.94 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 523.1 (MH⁺)

実施例 346

25 2-[2-[3-(2-ジメチルカルバモイル-エチル)-4-ヒドロキシ-5-メチルフェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=7.2Hz), 2. 23 (3H, s), 2. 68 (2H, t, J=6.4Hz), 2. 80-2. 86 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4.8Hz), 2. 85 (3H, s), 2. 96 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 39 (2H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 67 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 8. 19 (1H, q, J=4.8Hz), 8. 54 (1H, s).

5 実施例 347

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-(2-エチルカルバモイル-エチル)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 0. 98 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7.2Hz), 2. 48-2. 53 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4.8Hz), 2. 82-2. 88 (2H, m), 3. 04-3. 12 (2H, m), 4. 28 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 7. 71 (1H, s), 8. 17-8. 24 (2H, m), 8. 55 (1H, s)

MS:m/e (ESI) 523. 3 (MH⁺)

15 実施例 348

2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-6-メトキシ-5-プロピル-1,2,3,5-テトラヒドロ-イソインドール-4-オン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 0. 97 (3H, t, J=7Hz), 1. 43 (18H, s), 1. 69 (2H, m), 4. 07 (3H, s), 4. 08 (2H, t, J=6Hz), 4. 56 (2H, s), 4. 79 (2H, s), 6. 04 (1H, s), 7. 79 (1H, s), 7. 98 (2H, s).

MS:m/e (ESI) 468. 0 (MH⁺)

実施例 349

8-第 3 ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-benz

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 42 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 2. 84 (3H, d, J=4Hz), 3. 72 (3H, s), 4. 29 (2H, q, J=7Hz)

, 4.34-4.38 (1H, m), 4.55-4.60 (1H, m), 4.85 (2H, s), 5.45 (2H, s), 5.50 (1H, m), 7.43-7.45 (1H, m), 7.51-7.53 (1H, m), 7.54 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=4Hz), 8.57 (1H, s).

実施例 350

8-第 3 ブチル-6-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン
-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.49 (9H, s), 2.69 (3H, s), 3.71 (3H, s), 4.33-4.38 (1H, m), 4.54-4.60 (1H, m), 4.86 (2H, s), 5.48-5.53 (1H, m), 5.51 (2H, s), 7.45 (2H, s), 7.53 (1H, s), 7.72 (1H, d, J=8Hz), 8.17 (1H, d, J=8Hz).

10 実施例 351

1-(3,5-ジ第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-[5-エトキシ-1-イミノ-6-(1-
メトキシプロピル)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン; 臭化水素
酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 0.83 (3H, t, J=7.2Hz), 1.30-1.42 (21H, m), 1.58-1.75 (2H, m), 3.20 (2H, s), 4.18 (2H, q, J=7.2Hz), 4.56 (1H, t, J=5.6Hz), 4.78 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.40 (1H, s), 7.77 (2H, s), 8.14 (1H, s), 9.08 (1H, brs), 9.72 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 495.3 (MH⁺)

実施例 352

20 1-(3,5-ジ第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-5,7-
ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

] 1.40 (3H, t, J=7.2Hz), 1.41 (18H, s), 4.25 (2H, q, J=7.2Hz), 4.83 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.77 (2H, s), 7.84 (1H, d, J=2.4Hz), 8.55 (1H, d, J=2.4Hz), 9.83 (1H, brs).

25 MS:m/e (ESI) 424.2 (MH⁺)

実施例 353

6-エトキシ-2-[2-(4-ヒドロキシ-3-メチルフェニル)-2-オキシエチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩
 1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1. 408 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 184 (3H, s), 2. 822 (3H, d, J=4.8Hz), 4. 274 (2H, q, J=6.8Hz),
 5 4. 836 (2H, s), 5. 403 (2H, s), 6. 942 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 519 (1H, s), 7. 729 (1H, d, J=8.4 Hz), 7. 779 (1H, s), 8. 17-8. 21 (1H, m), 8. 52-8. 56 (1H, m).

実施例 354

2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-(4-ヒドロキシ-3-メチルフェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

- 10 1H-NMR(DMSO-d6) δ :
 1. 393 (3H, t, J=6.8Hz),
 2. 184 (3H, s), 2. 310 (3H, s), 2. 577 (3H, s), 3. 986 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 819 (2H, s), 5. 44
 2 (2H, s), 6. 944 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 734 (1H, dd, J=2.0, 8.4Hz), 7. 781 (1H, s).

実施例 355

- 15 [2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸メチルエステル;臭化水素酸塩

- 1H-NMR(DMSO-d6) δ :
 1. 36-1. 43 (12H, m), 2. 82 (3H, d, J=4.8Hz), 3. 72 (3H, s), 4. 29 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 83 (2
 20 H, s), 5. 01 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 09 (1H, d, J=8.0Hz), 7. 52 (1H, s), 7. 84-7. 90 (2H, m),
 8. 19 (1H, q, J=4.8Hz), 8. 56 (1H, s).

実施例 356

- 25 2-(2-[3-[(アセチルメチルアミノ)-メチル]-4-ヒドロキシ-5-メチルフェニル]-2-オキシエチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩
 1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1. 411 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 094 (3H, s), 2. 215 (3H, s), 2. 824 (3H, d, J=4.8Hz), 3. 044 (3H, s), 4. 279 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 482 (2H, s), 4. 849 (2H, s), 5. 418 (2H, s), 6. 942 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 525 (1H, s), 7. 784 (1H, s), 8. 16-8. 22 (1H, m), 8. 558 (1H, s).

実施例 357

- 5 N-(5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-3-メチル-ベンジル)-N-メチル-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 393 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 093 (3H, s), 2. 212 (3H, s), 2. 314 (3H, s), 2. 579 (3H, s), 3. 04
10 8 (3H, s), 3. 989 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 483 (2H, s), 4. 840 (2H, s), 5. 491 (2H, s), 7. 801 (1H, s), 7. 790 (1H, s), 9. 836 (1H, s), 10. 792 (1H, s).

実施例 358

- 15 N-(2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-メチル-ベンジル)-N-メチル-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

2. 093 (3H, s), 2. 215 (3H, s), 2. 670 (3H, s), 3. 044 (3H, s), 4. 483 (2H, s), 4. 858 (2H, s),
5. 488 (2H, s), 7. 704 (1H, d, J=8.0Hz), 7. 790 (1H, s), 8. 150 (1H, d, J=8.0Hz).

実施例 359

- 20 N-(2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-メチル-ベンジル)-N-メチル-メタンスルホンアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

2. 226 (3H, s), 2. 657 (3H, s), 2. 699 (3H, s), 2. 968 (3H, s), 4. 264 (2H, s), 4. 803 (2H, s),
25 5. 402 (2H, s), 7. 664 (1H, d, J=8.0Hz), 7. 717 (2H, s), 8. 114 (1H, d, J=8.0Hz).

実施例 360

N-(6-[2-(3,5-ジ第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-7-イ
ミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)-アセトアミド;臭化水素
酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 42 (18H, s), 2. 18 (3H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 22 (1H, d, J=8. 2H
z), 8. 37 (1H, d, J=8. 2Hz), 10. 65 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 437. 2 (MH⁺)

実施例 361

(2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 37-1. 43 (12H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 25-4. 30 (4H, m), 4. 81 (2H, s) 5. 58 (2H, s)
, 7. 46-7. 52 (1H, m), 7. 72-7. 80 (2H, m), 8. 17-8. 22 (1H, m), 8. 52 (1H, s), 12. 07 (1H, brs
).

- 15 MS:m/e (ESI) 480. 1 (MH⁺)

実施例 362

2-(2-[3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 43 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 2. 13-2. 23 (2H, m), 2. 42-2. 48 (2H, m), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 3. 65-3. 71 (2H, m), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 66 (1H, d, J=1Hz), 7. 80 (1H, d, J=1Hz), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s).

実施例 363

- 25 2-(2-[3-第 3 ブチル-4-(2,2-ジメチルプロポキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチ
ル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチ

ルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 11 (9H, s), 1. 43 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 8. 85 (2H, s), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 22 (1H, d, J=9Hz), 7. 55 (1H, s), 7. 88 (1H, d, J=2Hz), 7. 92 (1H, dd, J=2Hz, 9Hz), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 8. 59 (s, 1H).

実施例 364

カルバミン酸 3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル エステル;臭化水素酸塩

- 10 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 42 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 57 (2H, s), 4. 86 (1H, s), 5. 47 (2H, s), 4. 55 (1H, s), 7. 82 (2H, s), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 7. 58 (1H, s), 7. 21 (1H, brs), 9. 46 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

実施例 365

- 15 N-{6-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-7-イミノ-2-メチル-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-3-イルメチル}-アセトアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

- 20 1. 39 (18H, s), 1. 92 (3H, s), 2. 65 (3H, s), 4. 39 (2H, d, J=6. 0Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 69 (2H, s), 7. 98 (1H, s), 8. 52 (1H, t, J=6. 0Hz).

実施例 366

{8-第 3 ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

- 25 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 51 (2H, t, J=4. 4Hz), 3. 66

(3H, s), 4.30 (6H, m), 4.84 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.06 (1H, s), 7.29 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=4.4Hz), 8.57 (1H, s), 9.19 (1H, s), 9.81 (1H, s).

実施例 367

5 [8-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル]-酢酸 ベンジル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.44 (3H, t, J=6.8Hz), 2.85 (3H, d, J=4.4Hz), 3.53 (2H, t, J=3.6Hz), 4.30 (2H, q, J=6.8Hz), 4.32 (2H, t, J=3.6Hz), 4.38 (2H, s), 4.84 (2H, s), 5.16 (2H, s), 5.39 (2H, s), 7.10 (1H, s), 7.20-7.35 (6H, m), 7.56 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=4.4Hz), 8.58 (1H, s), 9.20 (1H, s), 9.83 (1H, s).

実施例 368

15 [8-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル]-酢酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=6.8Hz), 2.84 (3H, d, J=4.8Hz), 3.50 (2H, t, J=4.4Hz), 4.14 (2H, s), 4.30 (4H, m), 4.84 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.07 (1H, d, J=1.6Hz), 7.27 (1H, d, J=1.6Hz), 7.53 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=4.8Hz), 8.57 (1H, s), 9.22 (1H, s), 9.82 (1H, s), 12.50 (1H, s).

実施例 369

20 [8-第3ブチル-6-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル]-酢酸;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 2.69 (3H, s), 4.12 (2H, s), 4.30 (2H, t, J=4.0Hz), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s)

), 7.07 (1H, s), 7.27 (2H, s), 7.71 (1H, d, J=7.6 Hz), 8.15 (1H, d, J=7.6 Hz), 9.85 (1H, s)

実施例 370

5 {4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルパモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-エチルフェノキシ}-酢酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 18 (t, 3H, J=7.2 Hz) 1.42 (t, 3H, J=7.2 Hz) 2.70 (q, 2H, J=7.2 Hz) 2.82 (d, 3H, J=4.8 Hz)
3.71 (s, 3H) 4.29 (q, 2H, J=7.2 Hz) 4.86 (s, 2H) 5.00 (s, 2H) 5.43 (s, 2H) 7.08 (d, 1H, J=8.0 Hz) 7.52 (s, 1H) 7.78~7.87 (m, 2H) 8.18 (q, 1H, J=4.8 Hz) 8.57 (s, 1H).

実施例 371

15 6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-オキシ-2-(3,4,5-トリメトキシフェニル)-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (3H, t, J=6.8 Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8 Hz), 3.76 (3H, s), 3.87 (6H, s), 4.28 (2H, q, J=7.2 Hz), 4.87 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.32 (2H, s), 7.54 (1H, s), 8.17-8.23 (1H, m), 8.56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 442.2 (MH⁺)

実施例 372

25 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-d]ピリミジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (18H, s), 2.84 (3H, s), 4.96 (2H, s), 5.59 (2H, s), 7.76 (2H, s), 9.26 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 395.2 (MH⁺)

実施例 373

6-エトキシ-2-[2-(4-ヒドロキシ-3-イソプロピル-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 193 (6H, d, J=6.8Hz), 1. 410 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 823 (3H, d, J=4.8Hz), 3. 20-3. 30 (1H, m), 4. 278 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 839 (2H, s), 5. 412 (2H, s), 6. 950 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 523 (1H, s), 7. 735 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 779 (1H, s), 8. 198 (1H, d, J=4.8Hz), 8. 552 (1H, s)

実施例 374

- 10 2-[2-(3-シクロペンチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 409 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 49-1. 84 (6H, m), 1. 92-2. 03 (2H, m), 2. 821 (3H, d, J=4.8Hz), 4. 276 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 835 (2H, s), 5. 413 (2H, s), 6. 944 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 522 (1H, s), 7. 727 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 785 (1H, s), 8. 18-8. 21 (1H, m), 8. 552 (1H, s).

実施例 375

- 20 N-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-N-メチル-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 36 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 11 (3H, s), 3. 10 (3H, s), 4. 16 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 48 (2H, s), 4. 79 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 22 (1H, d, J=8.8Hz), 7. 32 (1H, s), 7. 82 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 8. 09 (1H, d, J=8.8Hz), 9. 10 (1H, s), 9. 72 (1H, s), 11. 27 (1H, s).

実施例 376

6-エトキシ-2-[2-(3-エチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミ

ノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 149 (3H, t, J=7.6Hz), 1.407 (3H, t, 6.8Hz), 2.597 (3H, q, J=7.6Hz), 2.820 (3H, d, J=4.8Hz), 4.273 (2H, q, J=6.8Hz), 4.838 (2H, s), 5.406 (2H, s), 6.946 (1H, d, J=8.4Hz), 7.519 (1H, s), 7.70-7.78 (2H, m), 8.16-8.23 (1H, m), 8.549 (1H, s).

実施例 377

2-[2-(3-シクロペンチル-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 415 (3H, t, J=6.8Hz), 1.41-1.83 (6H, m), 1.92-2.03 (2H, m), 2.249 (3H, s), 4.273 (2H, q, J=6.8Hz), 4.834 (2H, s), 5.427 (2H, s), 7.522 (1H, s), 7.642 (1H, s), 7.657 (1H, s), 7.693 (1H, s), 7.756 (1H, s), 8.617 (1H, s).

実施例 378

- 15 N-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシベンジル}-N-メチル-メタンсульфонアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 37 (3H, t, J=6.8Hz), 1.41 (9H, s), 2.73 (3H, s), 3.02 (3H, s), 4.16 (2H, q, J=6.8Hz), 4.37 (2H, s), 4.79 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.21 (1H, dd, J=2.0, 8.8Hz), 7.32 (1H, d, J=2.0Hz), 7.80 (1H, s), 7.81 (1H, s), 8.09 (1H, d, J=8.8Hz), 9.10 (1H, s), 9.72 (1H, s), 12.06 (1H, s).

実施例 379

- 25 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35-1. 44 (15H, m), 4. 08 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 15 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 72 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 45 (3H, s), 7. 07 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 87 (1H, d, J=8. 8Hz), 9. 13 (1H, s), 9. 67 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 467. 1 (MH⁺)

5 実施例 380

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-カルバモイルメトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 35-1. 44 (12H, m), 2. 82 (3H, d, J=5. 2Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 66 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 03 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 33-7. 45 (2H, m), 7. 53 (1H, s), 7. 85 (1H, s), 7. 89 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 19 (1H, d, J=0. 8Hz), 8. 55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 481. 2 (MH⁺)

実施例 381

15 6-エトキシ-2-[2-(4-エトキシ-3-メチルカルバモイルフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 41 (6H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, s), 2. 83 (3H, s), 4. 29 (4H, qq, J=6. 8Hz, 7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 32 (1H, d, J=8. 4), 7. 53 (1H, s), 8. 07 (1H, d, J=8. 4), 8. 13 (1H, s), 8. 21 (1H, s), 8. 35 (1H, s), 8. 56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 453. 1 (MH⁺)

実施例 382

25 2-エトキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-N-メチル-ペンザミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 67 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4.4Hz), 4. 29 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 32 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 70 (1H, d, J=8.4Hz), 8. 08 (1H, d, J=8.4Hz), 8. 12-8. 17 (2H, m), 8. 35 (1H, s).

実施例 383

5 2-エトキシ-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-N-メチル-ベンズアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 40 (6H, t, J=6.8Hz), 2. 32 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4.4Hz), 4. 01 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 29 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 32 (1H, d, J=8.4Hz), 8. 08 (1H, J=8.4Hz), 8. 13 (1H, d, J=4.4Hz), 8. 35 (1H, s), 9. 50 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

10

実施例 384

2-エトキシ-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-N-メチル-ベンズアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 44 (18H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 70 (1H, dd, J=2.4, 9.6Hz), 7. 77-7. 86 (3H, m), 7. 89 (1H, d, J=9.6Hz), 7. 95 (1H, d, J=2.4Hz), 7. 99 (1H, m), 8. 08 (1H, s), 8. 49 (2H, d, J=3.2Hz), 9. 31 (1H, s), 9. 82 (1H, s).

15

実施例 385

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-5-(ピリジン-3-イルオキシ)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

20

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 44 (18H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 51 (1H, dd, J=2.4, 8.8Hz), 7. 55 (1H, d, J=2.4Hz), 7. 77-7. 84 (3H, m), 8. 00 (1H, m), 8. 09 (1H, m), 8. 28 (1H, d, J=8.8Hz), 8. 46-8. 53 (2H, m), 9. 24 (1H, s), 9. 22 (1H, s).

25

実施例 386

2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ

[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 第3ブチル エステル;

臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 37-1.42(12H, m), 1.43(9H, s), 2.32(3H, s), 2.58(3H, s), 3.99(2H, q, J=6.8Hz), 4.8
5 3(2H, s), 4.86(2H, s), 5.50(2H, s), 7.05(1H, d, J=8.8Hz), 7.86(1H, d, J=2.0Hz), 7.90
(1H, dd, J=8.8 and 2.0Hz), 9.40-9.47(1H, m), 9.82-9.89(1H, m).

MS:m/e (ESI) 510.3 (MH⁺)

実施例 387

[2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ

10 [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1.34-1.67(12H, m), 2.31(3H, s), 2.58(3H, s), 3.99(2H, q, J=6.8Hz), 4.83(2H, s), 4.8
9(2H, s), 5.50(2H, s), 7.07(1H, d, J=8.8Hz), 7.85(1H, d, J=2.0Hz), 7.89(1H, dd, J=8.
8 and 2.0Hz), 9.40-9.49(1H, m), 9.81-9.91(1H, m).

15 MS:m/e (ESI) 454.2 (MH⁺)

実施例 388

[2-第3ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

20 1.40(9H, s), 1.40(3H, t, J=7.0Hz), 4.27(2H, q, J=7.0Hz), 4.85(2H, s), 4.88(2H, s), 5
.46(2H, s), 7.07(1H, d, J=8.4Hz), 7.53(1H, s), 7.69(1H, brs), 7.76(1H, brs), 7.86(1
H, s), 7.88(1H, d, J=8.4Hz), 8.63(1H, s), 9.20-9.26(1H, m), 9.85(1H, brs).

MS:m/e (ESI) 468.1 (MH⁺)

実施例 389

25 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[7-イミノ-2-(2-メチル-2H-
ピラゾール-3-イル)-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル]-エタノン;

臭化水素酸塩1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 41 (18H, s), 4. 24 (3H, s) 4. 96 (2H, s), 5. 62 (2H, s), 6. 99 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 79 (2H, s), 8. 22 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 35 (1H, d, J=8. 0Hz).

5 MS:m/e (ESI) 460. 2 (MH⁺)

実施例 390

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-7-フルオロ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インゾインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 33 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (18H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 29 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 9 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 29 (1H, s), 8. 36-8. 41 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 498. 2 (MH⁺)

実施例 391

15 {2-第3ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 40 (9H, s), 2. 68 (3H, s), 4. 86 (2H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 08 (1H, d, J=9. 2Hz), 7. 71 (1H, d, J=7. 2Hz), 7. 86 (1H, s), 7. 89 (1H, d, J=9. 2Hz), 8. 15 (1H, d, J=7. 2Hz), 9.

20 57 (1H, s), 9. 95 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 394. 0 (MH⁺)

実施例 392

{4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-インゾインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

25 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 85 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 84

(2H, s), 4.85 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.06 (1H, d, J=8.0Hz), 7.50 (1H, s), 7.53 (1H, s), 7.64 (1H, d, J=7.8Hz), 8.19 (1H, q, J=4.8Hz), 8.56 (1H, s), 9.27 (1H, s), 9.85 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 456.1 (MH⁺)

実施例 393

- 5 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(1-イミノ-5-メトキシ-7-メチル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (18H, s), 2.63 (3H, s), 3.85 (3H, s), 4.54 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.01 (1H, d, J=2Hz), 7.17 (1H, d, J=2Hz), 7.76 (2H, s).

- 10 MS: m/e (ESI) 423.0 (MH⁺)

実施例 394

1-{3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-[(2-ヒドロキシ-エチル)-メチル-アミノ]-フェニル}-2-(5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

- 15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (3H, t, J=7.2Hz), 1.40 (9H, s), 2.69 (3H, s), 2.86 (2H, t, J=4.8Hz), 3.58 (2H, t, J=4.8Hz), 4.18 (2H, q, J=7.2Hz), 4.78 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.22 (1H, d, J=8.8Hz), 7.33 (1H, s), 7.65 (1H, s), 7.69 (1H, s), 8.11 (1H, d, J=8.8Hz).

実施例 395

- 20 2-[2-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-チオクロマン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (6H, s), 1.44 (3H, t, J=7Hz), 1.53 (9H, s), 1.91-1.97 (2H, m), 2.85 (3H, d, J=5Hz), 3.08-3.14 (2H, m), 4.31 (2H, q, J=7Hz), 4.87 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.56 (1H, s), 7.77 (1H, s), 7.94 (1H, s), 8.22 (1H, q, J=5Hz), 8.59 (1H, s).

25

実施例 396

2-[2-(8-第 3 ブチル-4, 4-ジメチル-1-オキシ-チオクロマン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
メチルアミド; 臭化水素酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (3H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 1. 55 (3H, s), 1. 61 (9H, s), 2. 80-2. 90 (2H, m), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 3. 07-3. 27 (2H, m), 4. 61 (2H, q, J=7Hz), 4. 89 (2H, s), 5. 45-5. 68 (2H, m), 7. 57 (1H, s), 7. 86 (1H, s), 8. 13 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 59 (1H, s).

実施例 397

10 [2-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-5-エトキシ-6-メチルカルバモイル-2, 3-ジヒドロ-イソインドール-1-イリデン]-カルバミン酸 エチルエステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 37 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 46 (18H, s), 1. 55 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 01 (3H, t, J=4. 8Hz), 4. 25 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 32 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 63 (2H, s), 5. 11 (2H, s), 5. 80 (1H, s), 6. 98 (1H, s), 7. 88 (2H, s), 8. 82 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 552. 3 (MH⁺)

実施例 398

20 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-1-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 37 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 81 (1H, d, J=4. 4Hz), 4. 20 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 6. 96 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 77 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 81 (1H, s), 7. 94 (1H, s), 8. 01 (1H, s), 8. 24 (1H, d, J=4. 4Hz).

MS:m/e (ESI) 424. 2 (MH⁺)

実施例 399

2-[2-(2-第3ブチル-ピリジン-4-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 37 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 89 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 71 (1H, d, J=6. 4Hz), 7. 85 (1H, s), 8. 20 (1H, d, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s), 8. 82 (1H, d, J=5. 6Hz), 9. 24 (1H, brs), 9. 90 (1H, brs).

実施例 400

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-6-(ピリジン-4-イルオキシ)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 44 (18H, s), 4. 93 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 30 (2H, d, J=6. 8Hz), 7. 76-7. 83 (3H, m), 7. 96 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 12 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 52 (2H, d, J=6. 8Hz).

実施例 401

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-5-(ピリジン-4-イルオキシ)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 44 (18H, s), 4. 90 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 31 (2H, d, J=7. 2Hz), 7. 64 (1H, dd, J=2. 0, 8. 4Hz), 7. 75 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 80 (2H, s), 8. 10 (1H, s), 8. 36 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 51 (2H, d, J=7. 2Hz), 9. 31 (1H, s), 10. 00 (1H, s).
- 20

実施例 402

2-[2-[8-第3ブチル-4-(2-ヒドロキシ-エチル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 36 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 43 (2H, t, J=6. 0Hz), 3. 50

(2H, t, J=4.0Hz), 3.63 (2H, t, J=6.0Hz), 4.25 (2H, t, J=4.0Hz), 4.29 (2H, q, J=6.8Hz), 4.85 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.22 (2H, s), 7.54 (1H, s), 8.22 (1H, q, J=4.8Hz), 8.57 (1H, s), 9.31 (1H, s), 9.88 (1H, s).

実施例 403

5 N-[6-[2-(3,5-ジメチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-メタンスルホンアミド:塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.42 (18H, s), 3.56 (3H, s), 4.80 (2H, s), 5.59 (2H, s), 7.26 (1H, d, J=8.8Hz), 7.78 (2H, s), 8.08 (1H, s), 8.17 (1H, d, J=8.8Hz), 9.50 (1H, s), 9.65 (1H, s), 11.19 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 473.2 (MH⁺)

実施例 404

15 2-[2-(3-シクロペンチル-5-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド:臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 1.21-1.33 (2H, m), 1.52-1.69 (2H, m), 1.74-1.80 (2H, m), 1.93-2.02 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 4.11-4.13 (1H, m), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.84 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.53 (1H, s), 7.65-7.71 (2H, m), 8.19-8.22 (1H, m), 8.56 (1H, s).

20 MS:m/e (ESI) 454.2 (MH⁺)

実施例 405

25 2-[2-(7-第3ブチル-2-ヒドロキシメチルベンゾフラン-5-イル)-2-オキシエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド:臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.42 (3H, t, J=6.8Hz), 1.49 (9H, s), 2.83 (3H, d, J=4.8Hz), 4.29 (2H, q, J=7.2Hz), 4.64

(2H, d, J=6.0Hz), 4.88(2H, s), 5.85(2H, d, J=6.0Hz), 6.94(1H, s), 7.55(1H, s), 7.77(1H, s), 8.19-8.23(1H, m), 8.24(1H, s), 8.57(1H, s).

MS:m/e (ESI) 478.2 (MH⁺)

実施例 406

- 5 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(1-イミノ-5-メトキシ-7-メトキシメトキシ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.50(18H, s), 3.64(3H, s), 3.90(3H, s), 4.75(2H, s), 5.34(1H, s), 6.04(2H, s), 6.68(1H, d, J=2Hz), 6.80(1H, d, J=2Hz), 7.47(1H, brs), 8.00(2H, s).

- 10 MS:m/e (ESI) 470.0 (MH⁺)

実施例 407

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(7-ヒドロキシ-1-イミノ-5-メトキシ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.42(18H, s), 3.84(3H, s), 4.69(2H, s), 5.43(2H, s), 6.55(1H, s), 6.78(1H, s), 7.75(2H, s), 8.04(1H, s), 8.34(1H, s), 9.10(1H, s), 11.78(1H, s).

MS:m/e (ESI) 426.0 (MH⁺)

実施例 408

- 20 2-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.32-1.48(15H, m), 4.09(2H, q, J=7.2Hz), 4.15(2H, q, J=7.2Hz), 4.66(2H, s), 4.73(2H, s), 5.43(2H, s), 7.03(1H, d, J=8.8Hz), 7.35(1H, s), 7.36-7.44(2H, m), 7.78(1H, s), 7.86(1H, s), 7.90(1H, d, J=8.8Hz), 9.01-9.16(1H, brs), 9.50-9.65(1H, brs).

- 25 MS:m/e (ESI) 468.2 (MH⁺)

実施例 409

2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシフェニル)-2-オキシエチル]-6-
エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミ
ド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 41 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 3. 90 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=7Hz),
4. 87 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 47 (1H, s), 7. 55 (2H, s), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s)

実施例 410

11 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(3-ヒドロキシメチル-7-イミ
ノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 2. 58 (3H, s), 4. 69 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 60 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 8. 05-
8. 10 (1H, m), 8. 20 (1H, s), 9. 44-9. 50 (1H, m), 9. 85-9. 90 (1H, m).

実施例 411

15 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-[7-イミノ-2-メチル-3-(テト
ラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-
イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 42 (18H, s), 1. 30-1. 85 (6H, m), 2. 63 (3H, s), 3. 48-3. 55 (1H, m), 3. 75-3. 82 (1H, m), 4
. 68 (1H, d, J=14. 4Hz), 4. 79 (1H, brs), 4. 86 (2H, s), 4. 88 (1H, d, J=14. 4Hz), 5. 54 (2H, s
) , 7. 76 (2H, s), 8. 20 (1H, s), 9. 85-9. 95 (1H, m).

実施例 412

2-(3-アミノメチル-7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン
-6-イル)-1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-エタノン;塩酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 2. 74 (3H, s), 4. 23-4. 30 (2H, m), 4. 90 (2H, s), 5. 59 (2H, s), 7. 78 (2H, s),

8. 09 (1H, s), 8. 25 (1H, brs), 9. 55-9. 64 (1H, m), 9. 95-10. 02 (1H, m).

実施例 413

6-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-7-イミ
ノ-2-メチル-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-3-イルメチル]-カルバミ

5 ン酸 第 3 ブチル エステル; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (27H, s), 2. 64 (3H, s), 4. 28-4. 32 (2H, m), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 55-7. 60 (1
H, m), 7. 72 (2H, s), 7. 97 (1H, s).

実施例 414

10 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-ヒドロキシメチル-7-イミ
ノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素
酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (18H, s), 2. 67 (3H, s), 3. 89 (1H, brs), 4. 08 (1H, d, J=12. 0Hz), 5. 46 (2H, dd, J=18.
15 4Hz, 18. 4Hz), 7. 70 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 73 (2H, s), 8. 15 (1H, d, J=8. 0Hz).

実施例 415

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-カルバモイルメトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-
エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド; 臭
化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 26-1. 30 (12H, m), 4. 15 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 54 (2H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 33 (2H, s), 6. 9
1 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 24-7. 31 (2H, m), 7. 41 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 7. 65 (1H, s), 7. 78 (1H
, d, J=8. 8Hz), 8. 51 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 467. 1 (MH⁺)

25 実施例 416

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メタンスルフォニルアミノ-フェニル)-2-オキシ-エチ

ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチ
ルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39-1. 47 (12H, m), 2. 83 (3H, d, J=5. 2Hz), 3. 26 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 87 (2
5 H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 51-7. 60 (2H, m), 7. 84-7. 92 (1H, m), 7. 95-8. 03 (1H, m), 8. 16-8. 2
3 (1H, m), 8. 57 (1H, s), 8. 92 (1H, brs), 9. 21 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 501. 2 (MH⁺)

実施例 417

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチ
10 ルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミ
ド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 44 (18H, s), 2. 80 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 94 (6H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 17 (1H,
s), 7. 79 (2H, s), 8. 05 (1H, s), 8. 10 (1H, s), 8. 37 (1H, m), 8. 94 (1H, s), 9. 54 (1H, s).

15 実施例 418

6-クロロ-2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチ
ル]-7-フルオロ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチ
ルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 41 (18H, s), 2. 81 (3H, d, J=4. 4Hz), 5. 06 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 20 (1H,
s), 8. 64-8. 72 (1H, m).

MS: m/e (ESI) 488. 2 (MH⁺)

実施例 419

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-[1-イミノ-6-(1-メチルピペ
25 リジン-4-イルオキシ)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水
素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 44 (9H, s), 1. 85-2. 22 (4H, m), 2. 60 (3H, s), 2. 73-3. 12 (4H, m), 4. 61 (1H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 46 (1H, ddd, J=2. 4, 5. 2, 8. 8Hz), 7. 70 (1H, dd, J=5. 2, 8. 8Hz), 7. 80 (2H, s), 7. 87 (1H, dd, J=2. 4, 5. 2Hz), 8. 09 (1H, s), 9. 25 (1H, s), 9. 76 (1H, s).

5 実施例 420

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[1-イミノ-5-(1-メチル-ピペリジン-4-イルオキシ)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 44 (9H, s), 1. 86 (2H, m), 2. 14 (2H, m), 2. 59 (3H, s), 2. 92 (4H, m), 4. 78 (1H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 29 (1H, dd, J=2. 0, 8. 8Hz), 7. 44 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 79 (2H, s), 8. 11 (1H, d, J=8. 8Hz), 9. 06 (1H, s), 9. 72 (1H, s).

実施例 421

6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-オキシ-2-(5,6,7,8-テトラヒドロ-ナフタレン-2-イル)-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 408 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 73-1. 78 (4H, m), 2. 77-2. 83 (4H, m), 4. 276 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 856 (2H, s), 5. 470 (2H, s), 7. 276 (1H, d, J=7. 6Hz), 7. 526 (1H, s), 7. 716 (1H, s), 8. 17-8. 24 (1H, m), 8. 553 (1H, s).

実施例 422

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(6-エトキシ-3-イミノ-1,3-ジヒドロ-ピロロ[3,4-c]ピリジン-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 35 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 41 (18H, s), 4. 44 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 9. 02 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 424. 3 (MH⁺)

実施例 423

N-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロ
ロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-メタン sulfonアミド; 臭
化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 44 (9H, s), 2. 32 (3H, s), 2. 59 (3H, s), 3. 26 (3H, s), 3. 98 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 57 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 88 (1H, brd, J=8. 0Hz), 8. 00 (1H, brs), 8. 92 (1H, brs), 9. 40-9. 51 (1H, m), 9. 85-9. 94 (1H, m).

10 MS:m/e (ESI) 473. 2 (MH⁺)

実施例 424

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-エトキシ-6-フルオロ-1-
イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 41 (18H, s), 4. 23 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 60 (1H, d, J=7. 0Hz), 7. 75 (2H, s), 8. 04 (1H, d, J=11. 0Hz).

実施例 425

2-[2-(3-シクロペンチル-5-エチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチ
ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチ
ルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 150 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 408 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 45-1. 84 (6H, m), 1. 94-2. 04 (2H, m), 2. 662 (2H, q, J=7. 6Hz), 2. 824 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 276 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 835 (2H, s), 5. 438 (2H, s), 7. 523 (1H, s), 7. 628 (1H, s), 7. 670 (1H, s), 8. 17-8. 23 (1H, m), 8. 547 (1H, d, J=0. 8Hz).

実施例 426

N-{6-[2-(3,5-ジ第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-7-イ
ミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-N-エチル-アセトアミ
ド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 10 (3H, t, J=7.0Hz), 1.34 (18H, s), 2.07 (3H, s), 3.91 (2H, q, J=7.0Hz), 4.81 (2H, s),
5.29 (2H, s), 7.54 (2H, s), 7.85 (1H, d, J=8.2Hz), 8.27 (1H, d, J=8.2Hz).

MS:m/e (ESI) 465.2 (MH⁺)

実施例 427

- 10 N-{2-第3ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジ
ン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-メタンスルホンアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.44 (9H, s), 2.69 (3H, s), 4.88 (2H, s), 5.57 (2H, s), 7.53-7.58 (1H, m), 7.72 (1H, d, J=
8.0Hz), 7.82-8.00 (2H, m), 8.18 (1H, d, J=8.0Hz).

実施例 428

- 15 7-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾフラン-2-カルボン酸 メチルエステ
ル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.42 (3H, t, J=6.8Hz), 1.51 (9H, s), 2.83 (3H, d, J=4.8Hz), 3.93 (3H, s), 4.29 (2H, q, J=
6.8Hz), 4.89 (2H, s), 5.61 (2H, s), 7.55 (1H, d, J=1.2Hz), 7.95 (1H, d, J=1.2Hz), 7.97 (
1H, s), 8.18-8.22 (1H, m), 8.44 (1H, s), 8.58 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 506.2 (MH⁺)

実施例 429

- 25 8-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]ジオキシン
-2or3-カルボン酸 第3ブチル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (9H, s), 1. 43 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 2. 84 (3H, d, J=5Hz), 4. 25-4. 35 (1H, m),
4. 30 (2H, q,

J=7Hz), 4. 51-4. 57 (1H, m), 4. 85 (2H, s), 5. 30-5. 34 (1H, m), 5. 46 (2H, s), 7. 46 (1H, d, J

5 =3Hz), 7. 52 (1H, d, J=3Hz), 7. 55 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (s,

1H), 9. 22 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

実施例 430

2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-
エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドル-5-カルボン酸 アミド; 臭

10 化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 45 (3H, t, J=7Hz), 3. 89 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 47 (1H, s), 7. 55 (2H, s), 7. 71 (1H, s), 7. 78 (1H, s), 8. 64 (1H, s).

実施例 431

15 2-[2-(3-第3ブチル-4-メタンスルフォニルアミノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-
エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドル-5-カルボン酸 アミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38-1. 46 (12H, m), 3. 27 (3H, s), 4. 29 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 5
20 3-7. 60 (2H, m), 7. 68-7. 72 (1H, m), 7. 76-7. 81 (1H, m), 7. 86-7. 91 (1H, m), 8. 00 (1H, s),
8. 64 (1H, s), 8. 93 (1H, brs), 9. 22 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 487. 2 (MH⁺)

実施例 432

25 1-(3-シクロペンチル-5-エチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミ
ノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 塩酸
塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 151 (3H, t, J=7.6 Hz), 1.393 (3H, t, J=6.8 Hz), 1.46-1.82 (6H, m), 1.94-2.03 (2H, m),
2.311 (3H, s), 2.579 (3H, s), 2.662 (2H, q, J=7.6 Hz), 3.054 (3H, s), 3.988 (2H, q, J=6.8
Hz), 4.820 (2H, s), 5.503 (2H, s), 7.630 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.673 (1H, d, J=2.0 Hz), 9.32
4 (1H, s), 9.454 (1H, s).

実施例 433

2-[2-(3-第3ブチル-5-シクロペンチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.392 (9H, s), 1.37-1.43 (3H, m), 1.40-1.84 (6H, m), 1.96-2.06 (2H, m), 2.822 (3H, d, J=4.4 Hz), 4.276 (2H, q, J=6.8 Hz), 4.835 (2H, s), 5.473 (2H, s), 7.530 (1H, s), 7.709 (1H, s), 7.690 (1H, s), 8.18-8.24 (1H, m), 8.545 (1H, s).

実施例 434

1-(3-第3ブチル-5-シクロペンチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.391 (9H, s), 1.37-1.43 (3H, m), 1.40-1.85 (6H, m), 1.96-2.07 (2H, m), 2.311 (3H, s),
2.578 (3H, s), 3.987 (2H, q, J=7.6 Hz), 4.807 (2H, s), 5.495 (2H, s), 7.683 (1H, s), 7.70
7 (1H, s).

実施例 435

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-エトキシ-6-フルオロ-1-イミノ-7-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.41 (18H, s), 4.05 (3H, d, J=3.0 Hz), 4.22 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.7

1 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.24 (1H, d, J=6.0Hz), 7.75 (2H, s), 7.60 (1H, d, J=7.0Hz), 7.75 (2H, s), 8.04 (1H, d, J=11.0Hz).

MS:m/e (ESI) 471.2 (MH⁺)

実施例 436

- 5 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(7-イミノ-3-プロピル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.92 (3H, t, J=5.0Hz), 1.41 (18H, s), 1.67 (2H, dd, J=5.3, 5.0Hz), 2.77 (2H, t, J=5.3Hz), 4.88 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.78 (2H, s), 8.08 (1H, brs), 8.12 (1H, brs), 8.77 (1H, s), 9.40 (1H, brs), 10.02 (1H, brs).

10

MS:m/e (ESI) 422.2 (MH⁺)

実施例 437

2-(2-アミノ-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (18H, s), 4.64 (2H, s), 5.49 (2H, s), 6.53 (2H, s), 6.86 (1H, d, J=8.6Hz), 7.76 (2H, s), 7.78 (1H, d, J=8.6Hz), 9.40 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 395.1 (MH⁺)

実施例 438

- 20 6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-(4-メトキシ-3-トリフルオロメチルフェニル)-2-オキソ-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.42 (3H, t, J=7.2Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 4.02 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz), 4.87 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.49 (1H, d, J=8.0Hz), 7.54 (1H, s), 8.17 (1H, s), 8.20-8.22 (1H, m), 8.29 (1H, d, J=8.0Hz), 8.57 (1H, s).

25

MS:m/e (ESI) 450. 1 (MH⁺)

実施例 439

2-(2-Biphenyl-3-yl-2-oxo-ethyl)-6-ethoxy-3-imino-2,3-dihydro-1H-isoindol
e-5-carboxylic acid methylamide; hydrobromide

5 1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 44 (3H, t, J=7z), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 4. 31 (2H, q, J=7Hz), 4. 92 (2H, s), 5. 64 (2H, s),
7. 42-7. 48 (1H, m), 7. 51-7. 58 (3H, m), 7. 71-7. 80 (3H, m), 8. 00-8. 08 (2H, m), 8. 23 (1H,
q, J=5Hz), 8. 27-8. 29 (1H, m), 8. 60 (1H, s).

実施例 440

10 6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-オキシ-2-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-エチ
ル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸 メチルアミド; 臭化水素酸
塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 62
15 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 87 (1H, t, J=8. 4Hz), 8. 12 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 19-8. 23 (1H, m),
8. 28 (1H, s), 8. 31 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 57 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 420. 1 (MH⁺)

実施例 441

20 ([3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドル-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル)-メチル-アミ
ド)-酢酸; 臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 75 (3H, s), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 71 (2H, s), 4
30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 66 (1H, d, J=1. 2Hz), 7.
25 84 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 22 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 22 (1H, s), 9. 85 (1H, s).

実施例 442

2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 40 (9H, s), 2. 80 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 94 (6H, s), 3. 89 (3H, s), 4. 76 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 45 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, J=2. 0Hz), 8. 09 (1H, s), 8. 38 (1H, m), 8. 97 (1H, s), 9. 54 (1H, s), 9. 66 (1H, s).

実施例 443

- 10 1-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 20-1. 50 (12H, m), 2. 31 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 99 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 9. 33-9. 48 (1H, m), 9. 67 (1H, s), 9. 80-9. 92 (1H, m).

MS: m/e (ESI) 426. 2 (MH⁺)

実施例 444

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-1-オキサ-4,6-ジアザ-s-インダセン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 2. 61 (3H, s), 4. 90 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 03 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 40 (1H, s), 10. 04 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 434. 2 (MH⁺)

実施例 445

- 25 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7.0Hz), 4. 10 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 79 (2H, s), 4. 88 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 06 (1H, d, J=8.5Hz), 7. 32 (1H, s), 7. 85 (1H, s), 7. 88 (1H, d, J=8.5Hz).

5 実施例 446

2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-4-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシカルボニルアミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ)-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 33 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 40 (9H, s), 3. 72 (3H, s), 4. 25 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 89 (2H, s), 4. 91 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 07 (1H, d, J=8.0Hz), 7. 85 (1H, s), 7. 89 (1H, d, J=8.0Hz), 8. 46 (1H, s), 9. 30 (1H, s).

実施例 447

15 6-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 35 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 41 (18H, s), 2. 77 (3H, d, J=4.2Hz), 4. 25 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 76 (2H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 53 (1H, brq, J=4.2Hz), 9. 40 (1H, brs), 9. 95 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 481. 2 (MH⁺)

実施例 448

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-ジエチルアミノ-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 13 (6H, t, J=6.8Hz), 1. 42 (18H, s), 3. 60 (4H, q, J=6.8Hz), 4. 65 (2H, s), 5. 50 (2H, s),

7.01 (1H, d, J=8.8Hz), 7.77 (2H, s), 7.84 (1H, d, J=8.8Hz), 9.28 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 451.3 (MH⁺)

実施例 449

5 2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-
エトキシ-7-フルオロ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.32 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.88 (2H, s), 4.29 (2H, q, J=6.8Hz), 4.99 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.46 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.29 (1H, s), 8.36-8.43 (1H, m).

10

MS:m/e (ESI) 472.2 (MH⁺)

実施例 450

15 [2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-4-フルオロ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-酢酸;臭化水素
酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.33 (3H, t, J=7.2Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 4.29 (2H, q, J=6.8Hz), 4.89 (2H, s), 5.00 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.08 (1H, d, J=8.4Hz), 7.86 (1H, d, J=2.4Hz), 7.89 (1H, dd, J=2.4, 8.4Hz), 8.29 (1H, s), 8.36-8.41 (1H, m), 9.47 (1H, s), 10.04 (1H, s).

20

MS:m/e (ESI) 500.2 (MH⁺)

実施例 451

25 1-(8-第3ブチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]ジオキシシン-6-イル)-2-(7-イミノ
-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; compound
with 酢酸 第3ブチル エステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (9H, s), 1.44 (9H, s), 2.68 (3H, s), 4.27-4.32 (1H, m), 4.52-4.57 (1H, m), 4.86 (2H

, s), 5.30-5.35 (1H, m), 5.53 (2H, s), 7.46 (2H, d, J=2Hz), 7.52 (1H, d, J=2Hz), 7.72 (1H, d, J=8Hz), 8.33 (1H, d, J=8Hz).

実施例 452

5 {3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (9H, s), 2.69 (3H, s), 3.72 (3H, s), 4.86 (2H, s), 4.93 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.41 (1H, d, J=1Hz), 7.57 (1H, d, J=1Hz), 7.72 (1H, d, J=8Hz), 8.17 (1H, d, J=8Hz).

10 実施例 453

{3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-酢酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.41 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=7Hz), 2.85 (3H, d, J=5Hz), 3.73 (3H, s), 4.30 (2H, q, J=7z), 4.86 (2H, s), 4.93 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.42 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.57 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=5Hz), 8.58 (1H, s).

実施例 454

20 1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシフェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (9H, s), 2.69 (3H, s), 3.90 (3H, s), 4.88 (2H, s), 5.58 (2H, s), 7.47 (1H, d, J=2Hz), 7.55 (1H, d, J=2Hz), 7.73 (1H, d, J=8Hz), 8.18 (1H, d, J=8Hz).

実施例 455

25 3-{3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-プロパン酸 メ

チルエステル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 2. 52 (2H, t, J=8Hz), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 2. 97 (2H, t, J=8Hz), 3. 62 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 71 (1H, s), 7. 73 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s).

実施例 456

8-第 3 ブチル-6-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]ジオキシン-2or3-カルボン酸;ト
リフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 43 (9H, s), 2. 69 (3H, s), 4. 31-4. 37 (1H, m), 4. 51-4. 57 (1H, m), 4. 87 (2H, s), 5. 30-5. 35 (1H, m), 5. 52 (2H, s), 7. 45 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 73 (1H, d, J=8Hz), 8. 17 (1H, d, J=8Hz), 9. 52 (1H, s), 9. 97 (1H, s).

実施例 457

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-イミダゾール-1-イルメチル-7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノ
ン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (18H, s), 2. 64 (3H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 26 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 6. 99 (1H, s), 7. 20 (1H, s), 7. 50 (3H, brs), 7. 77 (1H, s).

実施例 458

6-[2-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-
エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチ
ルアミド;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4. 0Hz), 3. 87 (3H, s), 4. 24 (2H, q, J=

7. 0Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 8. 00 (1H, s), 8. 52 (1H, br q, J=4. 0Hz), 9. 45 (1H, brd, J=8. 0Hz), 9. 67 (1H, s), 9. 94 (1H, brd, J=8. 0Hz).

実施例 459

5 {2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸:塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35 (3H, t, J=6. 9Hz), 1. 39 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4. 0Hz), 4. 23 (2H, q, J=6. 9Hz), 4. 83 (2H, s), 4. 88 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 05 (1H, d, J=7. 7Hz), 7. 85 (1H, s), 7. 88 (1H, d, J=7. 7Hz), 7. 98 (1H, s), 8. 56 (1H, brq, J=4. 0Hz), 9. 95 (1H, s).

10 実施例 460

2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-安息香酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 37 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 86 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 55 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 91 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 06 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 57 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 466. 2 (MH⁺)

実施例 461

20 {2-[2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-5-エトキシ-4-フルオロ-6-メチルカルバモイル-2,3-ジヒドロ-イソインドール-1-イリデン}-カルバミン酸 イソプロペニル エステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 46 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 47 (18H, s), 2. 07 (3H, d, J=0. 4Hz), 3. 01 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 35 (2H, dq, J=1. 2, 6. 8Hz), 4. 73 (3H, s), 4. 90 (1H, s), 5. 13 (2H, s), 5. 83 (1H, s), 7. 88 (2H, s), 8. 63 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 582. 3 (MH⁺)

実施例 462

2-[2-(3-第3ブチルフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジ
ヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 322 (9H, s), 1. 405 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 90 (2H, s), 4. 20-4. 32 (2H, m), 4. 869 (2H, s), 5. 533 (2H, s), 7. 45-7. 58 (2H, m), 7. 75-7. 86 (2H, m), 7. 972 (1H, s), 8. 18-8. 22 (1H, m), 8. 547 (1H, d, J=1. 2Hz).

実施例 463

2-[2-(3-第3ブチル-5-エチルフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミ
ノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 215 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 317 (9H, s), 1. 408 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 700 (2H, q, J=7. 6Hz), 2. 821 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 276 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 863 (2H, s), 5. 517 (2H, s), 7. 470 (1H, s), 7. 531 (1H, s), 7. 612 (1H, s), 7. 679 (1H, s), 7. 799 (1H, s), 8. 19-8. 22 (1H, m).

15 実施例 464

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(7-イミノ-2-モルフォリノ
-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 41 (18H, s), 3. 64 (4H, t, J=4. 6Hz), 3. 72 (4H, t, J=4. 6Hz), 4. 70 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 26 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 76 (2H, s), 7. 94 (1H, d, J=8. 8Hz), 9. 45 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 465. 2 (MH⁺)

実施例 465

4-{6-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-7-イ
ミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-ピペラジン-1-カルボン
酸 第3ブチル エステル;臭化水素酸塩

25

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (27H, s), 3. 44 (4H, t, J=4. 8Hz), 3. 68 (4H, br), 4. 70 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 27 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 76 (2H, s), 7. 94 (1H, d, J=8. 8Hz), 9. 46 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 564. 4 (MH⁺)

実施例 466

- 5 6-[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-2-エトキシ-5-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-3-カルボン酸 メチルアミド; 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 32-1. 48 (12H, m), 2. 80-2. 87 (3H, m), 4. 58 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 25-8. 33 (1H, m), 8. 93 (1H, s), 9. 30-9. 38 (1H, m), 9. 95-10. 02 (1H, m)

MS: m/e (ESI) 481. 2 (MH⁺)

実施例 467

- 15 1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-ピペラジン-1-イル)-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン; 2 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (18H, s), 3. 19 (4H, br), 3. 93 (4H, t, J=4. 8Hz), 4. 72 (2H, s), 5. 58 (2H, s), 7. 35 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 78 (2H, s), 8. 00 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 07 (1H, s), 9. 36 (2H, br), 9. 51 (1H, s), 9. 60 (1H, s).

- 20 MS: m/e (ESI) 464. 2 (MH⁺)

実施例 468

- 25 2-(2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ)-2-メチル-プロパン酸 第 3 ブチル エステル; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35 (9H, s) 1. 39 (9H, s) 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz) 1. 65 (6H, s) 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz) 4. 27 (2

H, q, J=7.2Hz) 4.84 (2H, s) 5.43 (2H, s) 6.68 (1H, d, J=8.8Hz) 7.52 (1H, s) 7.86 (1H, d, J=8.8Hz) 7.87 (1H, s) 8.19 (1H, q, J=4.8Hz) 8.55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 566.4 (MH⁺)

実施例 469

- 5 2-[2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-2-メチルプロパン酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.34-1.46 (12H, m), 1.66 (6H, s), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 4.27 (2H, q, J=7.2Hz), 4.84 (2H, s), 5.45 (2H, s), 6.73 (1H, d, J=8.8Hz), 7.53 (1H, s), 7.85 (1H, d, J=8.8Hz), 7.87 (1H, s), 8.19 (1H, q, J=4.8Hz), 8.56 (1H, s), 9.25 (1H, brs), 9.86 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 510.2 (MH⁺)

実施例 470

- 15 酢酸 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-5-エトキシ-4-フルオロ-6-メチルカルバモイル-2,3-ジヒドロ-イソインドール-1-イリデンカルバモイルオキシメチルエステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.47 (3H, t, J=8.2Hz), 1.48 (18H, s), 2.18 (3H, s), 3.02 (3H, d, J=5.2Hz), 4.22 (2H, q, J=8.2Hz), 5.13 (2H, ABq, J=16.0Hz), 5.86 (1H, s), 5.89 (2H, s), 7.87 (2H, s), 8.46 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 614.3 (MH⁺)

実施例 471

- 25 2,2-ジメチル-プロピオン酸 2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-5-エトキシ-4-フルオロ-6-メチルカルバモイル-2,3-ジヒドロ-イソインドール-1-イリデンカルバモイルオキシメチルエステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 20, 1. 23 (9H, each

s), 1. 47 (18H, s), 1. 48 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 02 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 41 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 63 (2H, s), 5. 87 (1H, s), 5. 88 (2H, s), 7. 87, 7. 89 (1H, each s).

MS: m/e (ESI) 656. 4 (MH⁺)

5 実施例 472

3-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アクリル酸 メチルエステル; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 34-1. 43 (12H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 67 (3H, s), 4. 28 (2H, q, 7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 43 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 87 (1H, d, J=12Hz), 7. 92-8. 02 (3H, m), 8. 17-8. 23 (1H, m), 8. 56 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 508. 2 (MH⁺)

実施例 473

15 3-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プロパン酸 メチルエステル; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 32 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 89 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 62 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 36 (2H, t, J=6. 4Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 19 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 83 (1H, s), 7. 91 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 19 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, s).

実施例 474

25 [4-{2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,6-ジメトキシ-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 19 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 85 (6H, s), 4. 14 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 69 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 31 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 16-8. 23 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 39 (1H, brs), 9. 91 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 514. 3 (MH⁺)

実施例 475

〔2-第 3 プチル-4-[2-(1-イミノ-5, 7-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-酢酸; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 40 (9H, s), 3. 89 (3H, s), 3. 97 (3H, s), 4. 71 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 6. 75 (1H, s), 6. 91 (1H, s), 7. 07 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 85 (1H, s), 7. 87 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 45 (1H, brs), 9. 08 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 441. 1 (MH⁺)

実施例 476

15 3-{6-[2-(3-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-イル}-2-メチル-アクリルアミド 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 36 (9H, s), 2. 32 (3H, d, J=1. 2Hz), 3. 86 (3H, s), 4. 54 (2H, s), 5. 13 (2H, s), 7. 17-7. 21 (2H, br), 7. 31 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 62 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 06 (1H, d, J=8. 0Hz).

実施例 477

25 1-(3-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-[7-イミノ-2-メチル-3-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル]-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (9H, s), 1. 40-1. 90 (6H, m), 2. 62 (3H, s), 3. 45-3. 55 (1H, m), 3. 74-3. 82 (1H, m), 3. 88 (3H, s), 4. 67 (1H, d, J=14. 0Hz), 4. 76-4. 81 (1H, m), 4. 85 (2H, s), 4. 87 (1H, d, J=14. 0 Hz), 5. 50-5. 53 (2H, m), 7. 45 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 53 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 19 (1H, s).

実施例 478

- 5 1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-(3-ヒドロキシメチル-7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 88 (3H, s), 4. 69 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 45 (1 H, d, J=2. 0Hz), 7. 53 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 20 (1H, s).

10

実施例 479

(2-第 3 ブチル-4-[2-[7-イミノ-2-メチル-3-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル]-アセチル]-フェノキシ)-酢酸 第 3 ブチル エステル;臭化水素酸塩

- 15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (9H, s), 1. 44 (9H, s), 1. 30-1. 89 (6H, m), 2. 63 (3H, s) 3. 48-3. 55 (1H, m), 3. 75-3. 8 (2 (1H, m), 4. 68 (1H, d, J=14. 4Hz), 4. 79 (1H, t, J=1. 8Hz), 4. 86 (2H, s), 4. 87 (1H, d, J=14 . 4Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 05 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 86 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 90 (1 H, dd, J=8. 98, 2. 2Hz), 8. 20 (1H, s).

- 20 実施例 480

[2-第 3 ブチル-4-[2-(3-ヒドロキシメチル-7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ]-酢酸 第 3 ブチル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 40 (9H, s), 1. 44 (9H, s), 2. 58 (3H, s), 4. 68 (2H, s), 4. 84-4. 91 (2H, m), 4. 86 (2H, s), 5 . 55 (2H, s), 7. 05 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 86 (1H, brs), 7. 89 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 20 (1H, s),

9. 53 (1H, d, J=7. 2Hz), 9. 88 (1H, d, J=7. 2Hz).

実施例 481

1-(3-第 3 ブチル-4-[2-(3-ヒドロキシメチル-7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 2. 58 (3H, s), 4. 69 (2H, s), 4. 85-4. 93 (2H, m), 4. 90 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 08 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 86 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 89 (1H, dd, J=8. 8, 2. 0Hz), 8. 20 (1H, s), 9. 51 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 89 (1H, d, J=8. 4Hz).

実施例 482

10 1-(3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-[7-イミノ-2-メチル-3-(テトラヒドロピラ-ン-2-イルオキシメチル)-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル]-アセチル]-ベンジル)-ピペリジン-2-オン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 38 (9H, s), 1. 40-1. 80 (10H, m) 2. 30-2. 40 (2H, m), 3. 30-3. 40 (2H, m), 3. 42-3. 50 (2H, m), 4. 48 (2H, s), 4. 68 (1H, d, J=14. 4Hz), 4. 77-4. 80 (1H, m), 4. 88 (1H, d, J=14. 4Hz) 4. 88 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 83 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 87 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 20 (1H, s).

実施例 483

20 1-(3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(3-ヒドロキシメチル-7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル)-ピペリジン-2-オン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 65-1. 78 (4H, m) 2. 30-2. 40 (2H, m), 2. 58 (3H, s), 3. 40-3. 50 (2H, m), 4. 48 (2H, s), 4. 61 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 82 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 88 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 20 (1H, s), 9. 52 (1H, d, J=9. 2Hz), 9. 88 (1H, d, J=9. 2Hz), 11. 55 (1H, s).

25 実施例 484

1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フ

ルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7.0Hz), 3. 86 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 20 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 32 (1H, s), 7. 43 (1H, s), 7. 52 (1H, s).

実施例 485

6-[2-(3-第 3 ブチル-4-メタンスルフォニルアミノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (3H, t, J=6.9Hz), 1. 42 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4.0Hz), 3. 26 (3H, s), 4. 25 (2H, q, J=6.9Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 56 (1H, d, J=8.0Hz), 7. 88 (1H, d, J=8.0Hz), 8. 00 (2H, s), 8. 52 (1H, brq, J=4.0Hz), 8. 94 (1H, brs), 9. 50 (1H, brs), 9. 98 (1H, brs).

15 実施例 486

4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-フェノキシ-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (6H, d, J=6.0Hz) 1. 41 (3H, t, J=7.2Hz) 2. 82 (3H, d, J=4.8Hz) 4. 28 (2H, q, J=7.2Hz) 4. 60-4. 69 (1H, m) 4. 85 (4H, s) 5. 44 (2H, s) 7. 05 (1H, d, J=8.8Hz) 7. 51 (1H, s) 7. 53 (1H, s) 7. 62 (1H, d, J=8.8Hz) 8. 17-8. 23 (1H, m) 8. 56 (1H, s) 9. 24 (1H, brs) 9. 83 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 483. 9 (MH⁺)

実施例 487

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 31 (3H, t, J=7.6Hz), 1.42 (18H, s), 2.94 (2H, q, J=7.6Hz), 4.85 (2H, s), 5.56 (2H, s),
7.73 (1H, d, J=8.0Hz), 7.77 (2H, s), 8.18 (1H, d, J=8.0Hz), 9.85 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 408.2 (MH⁺)

実施例 488

5 2-[2-(4-アセチル-ピペラジン-1-イル)-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]
ピリジン-6-イル]-1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-エタノン;臭
化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.46 (18H, s), 2.17 (3H, s), 3.69-3.83 (8H, br), 4.74 (2H, s), 4.85 (2H, s), 7.23 (1H, d,
10 J=8.8Hz), 7.88 (1H, d, J=8.8Hz) 7.89 (2H, s).

MS:m/e (ESI) 506.3 (MH⁺)

実施例 489

6-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-2-
エトキシ-5-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-3-カルボン酸メ
15 チルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.33-1.44 (12H, m), 2.80-2.87 (3H, m), 3.88 (3H, s), 4.58 (2H, q, J=6.8Hz), 4.86 (2H, s
) , 5.48 (2H, s), 7.45 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.23-8.36 (1H, m), 8.93 (1H, s), 9.35-9.44 (1H, m),
9.68 (1H, s), 9.98-10.07 (1H, m).

20 MS:m/e (ESI) 455.2 (MH⁺)

実施例 490

6-[2-(3-シクロペンチル-4-ヒドロキシ-5-メチル-フェニル)-2-オキシ-エチ
ル]-2-エトキシ-5-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-3-カルボン
酸メチルアミド;塩酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (3H, t, J=7.2Hz), 1.46-1.83 (6H, m), 1.91-2.03 (2H, m), 2.25 (3H, s), 2.78-2.89 (

4H, m), 4.58 (2H, q, J=7.2Hz), 4.85 (2H, s), 5.42 (2H, s), 7.655 (1H, s), 7.664 (1H, s), 8.20-8.40 (1H, m), 8.93 (1H, s), 9.35 (1H, s), 9.37-9.49 (1H, m), 9.95-10.08 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 451.1 (MH⁺)

実施例 491

- 5 {2-第3ブチル-4-[2-(2-エトキシ-5-イミノ-3-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-
ロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ
酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.28-1.49 (12H, m), 2.84 (3H, d, J=4.8Hz), 4.58 (2H, q, J=6.8Hz), 4.86 (2H, s), 4.89 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.08 (1H, d, J=8.0Hz), 7.86 (1H, s), 7.90 (1H, d, J=8.0Hz), 8.25-8.39 (1H, m), 8.93 (1H, s), 9.34-9.45 (1H, m), 9.95-10.05 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 483.1 (MH⁺)

実施例 492

- 15 {2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ}-酢酸 メチルエス
テル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.48 (3H, s), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.73 (3H, s), 3.84 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.74 (2H, s), 4.85 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.53-7.55 (3H, m), 8.20 (1H, d, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s), 9.20 (1H, brs), 9.85 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 526.2 (MH⁺) 6

実施例 493

- 25 2-[2-[3-第3ブチル-4-(2-カルバモイル-エトキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチ
ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチ
ルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 31 (9H, s), 1. 38-1. 45 (3H, m), 2. 58-2. 65 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 23-4. 35 (4H, m), 4. 85 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 6. 94-7. 02 (1H, m), 7. 18 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 45-7. 56 (2H, m), 7. 83 (1H, s), 7. 91 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 15-8. 25 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 21 (1H, brs), 9. 82 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 495. 2 (MH⁺)

実施例 494

3-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プロパン酸:臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 34 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 77 (2H, t, J=6. 0Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 32 (2H, t, J=6. 0Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 19 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 84 (1H, s), 7. 91 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 20 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 26 (1H, brs,), 9. 85 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 496. 3 (MH⁺)

15 実施例 495

[2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ}-酢酸:トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 66 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=5. 2Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 18 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 512. 2 (MH⁺)

実施例 496

25 2-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プロパン酸:トリフルオロ

酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36-1. 48 (12H, m), 1. 59 (3H, d, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 08-5. 18 (1H, m), 5. 44 (2H, s), 6. 95-7. 00 (1H, m), 7. 53 (1H, s), 7. 80-7. 94 (2H, m), 8. 14-8. 26 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 19 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 496. 2 (MH⁺)

実施例 497

2-(2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ)-酪酸;トリフルオロ酢酸

塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 06 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 33-1. 57 (12H, m), 1. 94-2. 11 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 27 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 05 (1H, t, J=5. 6Hz), 5. 44 (2H, s), 6. 97 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 78-7. 97 (2H, m), 8. 11-8. 26 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 11-9. 24 (1H, m), 9. 76-9. 85 (1H, m).

実施例 498

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (18H, s), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 75 (2H, s).

実施例 499

1-(8-第3ブチル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=7. 1Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 48 (3H, t, J=7. 1Hz), 3. 23-3. 37 (2H, m), 2. 90 (3H, s), 4. 12 (2H, q, J=7. 1Hz), 4. 22 (2H, q, J=7. 1Hz), 4. 33 (2H, brs), 4. 79 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 16 (1H, s), 7. 27 (1H, s), 7. 33 (1H, s), 9. 04 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 484. 3 (MH⁺)

5 実施例 500

{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 第3ブチル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 31 (3H, t, J=7. 4Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 43 (9H, s), 2. 94 (2H, q, J=7. 4Hz), 4. 85 (4H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 05 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 73 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 86 (1H, d, J=1. 8Hz), 7. 90 (1H, dd, J=8. 4Hz, J=1. 8Hz), 8. 18 (1H, d, J=8. 0Hz).

MS:m/e (ESI) 466. 2 (MH⁺)

10 実施例 501

{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 31 (3H, t, J=7. 4Hz), 1. 40 (9H, s), 2. 94 (2H, q, J=7. 4Hz), 4. 86 (2H, s), 4. 88 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 08 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 73 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 86 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 90 (1H, dd, J=8. 6Hz, J=1. 6Hz), 8. 18 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 54 (1H, s), 9. 86 (1H, s).

20 MS:m/e (ESI) 410. 1 (MH⁺)

25 実施例 502

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-イソプロピル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 32 (6H, d, J=6. 8Hz), 1. 42 (18H, s), 3. 18-3. 28 (1H, m), 4. 84 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 75 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 77 (2H, s), 8. 18 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 72 (1H, br).

MS: m/e (ESI) 422. 2 (MH⁺)

実施例 503

2-[2-(8-第 3 ブチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]ジオキシン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 4. 31 (2H, q, J=7Hz), 4. 32-4. 43 (4H, m), 4. 86 (2H, s), 5. 46 (2H, s,), 7. 44 (1H, s), 7. 47 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s).

10 実施例 504

2-[2-(3-第 3 ブチル-4, 5-ジメトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 38 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 3. 89 (3H, s), 3. 91 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 55 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=8Hz), 8. 58 (1H, s).

実施例 505

1-(8-第 3 ブチル-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2, 4-ジメチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 33 (3H, s), 2. 60 (3H, s), 2. 93 (3H, s), 4. 01 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 36 (2H, t, J=4. 4Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 19 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 29 (1H, d, J=1. 6Hz), 9. 20-10. 00 (2H, brs).

実施例 506

3-[2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル]-アクリル酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 39-1. 46 (12H, m) 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz) 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz) 4. 87 (2H, s) 5. 53 (2H, s)
6. 35 (1H, d, J=16Hz) 7. 54 (1H, s) 7. 79 (1H, d, J=8. 0Hz) 7. 90 (1H, d, J=8. 0Hz) 7. 99 (1H, s)
8. 17-8. 23 (1H, m) 8. 27 (1H, d, J=16Hz) 8. 57 (1H, s) 9. 26 (1H, brs) 9. 87 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 478. 2 (MH⁺)

実施例 507

10 7-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メチル-ベンゾフラン-3-カルボン酸;トリ
フルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 49 (9H, s), 2. 81 (3H, s), 2. 83 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 29 (2H, q, J=
6. 8Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 62 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 81 (1H, s), 8. 18-8. 24 (1H, m), 8. 47 (
1H, s), 8. 57 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 566. 2 (MH⁺)

実施例 508

20 3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-安息香酸;トリフルオロ酢酸
塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 40 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85
(2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 98 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 12-8. 22 (1H, m), 8. 38 (1H,
d, J=2. 4Hz), 8. 56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 468. 2 (MH⁺)

実施例 509

3-(2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル)-プロパン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 41 (9H, s), 2. 55 (2H, t, J=8. 0Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 17 (2H, t, J=8. 0Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 48 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 81 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 93 (1H, s), 8. 16-8. 24 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 23 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 480. 2 (MH⁺)

10 実施例 510

2-(2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ)-プロパン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 34-1. 47 (12H, m), 1. 59 (3H, d, J=6. 4Hz), 2. 31 (3H, s), 2. 58 (3H, s), 3. 99 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 13 (1H, q, J=6. 4Hz), 5. 49 (2H, s), 6. 97 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 86 (1H, s), 7. 88 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 36-9. 45 (1H, m), 9. 81-9. 90 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 468. 2 (MH⁺)

実施例 511

- 20 2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン)-1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 03-1. 12 (4H, m), 1. 41 (18H, s), 2. 26-2. 36 (1H, m), 4. 81 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 71 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 76 (2H, s), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 63 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 420. 2 (MH⁺)

実施例 512

12-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 39(9H, s), 3. 85(3H, s), 3. 95(3H, s), 4. 81(2H, s), 4. 88(2H, s), 5. 47(2H, s), 7. 07(1H, d, J=8. 8Hz), 7. 35(1H, s), 7. 82-7. 90(2H, m).

実施例 513

1-(8-第3ブチル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イ
ル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-インインドール-2-
イル)-エタノン;塩酸塩

10

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34(9H, s), 2. 90(3H, s), 3. 25-3. 36(3H, m), 3. 86(3H, s), 3. 95(3H, s), 4. 33(2H, dd, J=5. 5, 4. 1Hz), 4. 79(2H, s), 5. 44(2H, s), 7. 15(1H, s), 7. 26(1H, s), 7. 35(1H, s).

実施例 514

- 15 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-イミノ-2-(ピロリジン-1-
イル)-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41(18H, s), 1. 94-2. 00(4H, br), 3. 45-3. 52(4H, br), 4. 67(2H, s), 5. 50(2H, s), 6. 87(1H, d, J=8. 8Hz), 7. 76(2H, s), 7. 86(1H, d, J=8. 8Hz), 9. 25(2H, s).

- 20 MS: m/e (ESI) 449. 2 (MH⁺)

実施例 515

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-[2-(ethyl-メチル-アミ
ノ)-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル]-エタノン;臭化水
素酸塩

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 10(3H, t, J=7. 0Hz), 1. 41(18H, s), 3. 09(3H, s), 3. 67(2H, q, J=7. 0Hz), 4. 66(2H, s),

5. 50 (2H, s), 7. 04 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 77 (2H, s), 8. 86 (1H, d, J=8. 8Hz), 9. 32 (2H, s).

MS: m/e (ESI) 437. 2 (MH⁺)

実施例 516

2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-
5 イソインドール-2-イル)-アセチル]-安息香酸:塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ:

1. 42 (9H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 48-7. 56 (2H, m), 7. 89 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 03 (1H, s), 8. 15-8. 23 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 30 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

10 MS: m/e (ESI) 452. 1 (MH⁺)

実施例 517

2-[2-(4-第3ブチルフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジ
15 ヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ:

15 1. 32 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 63 (2H, d, J=7. 2Hz), 7. 95 (2H, d, J=7. 2Hz), 8. 18-8. 24 (1H, m), 8. 56 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 408. 1 (MH⁺)

実施例 518

20 1-(8-第3ブチル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イ
ル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イ
ル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ:

25 1. 03-1. 16 (4H, m), 1. 35 (9H, s), 2. 26-2. 37 (1H, m), 2. 91 (3H, s), 4. 34 (2H, brs), 4. 82 (2H, s), 5. 52 (2H, brs), 7. 17 (1H, s), 7. 28 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 42-9. 53 (1H, m), 9. 60-9. 71 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 419.1 (MH⁺)

実施例 519

2-[2-(3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-
エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミ
ド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.34 (6H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz), 4.37
(2H, s), 4.85 (2H, s), 5.43 (2H, s), 6.98 (1H, d, J=8.0Hz), 7.53 (1H, s), 7.87 (1H, d, J=8
.0Hz), 7.89 (1H, s), 8.14-8.25 (1H, m), 8.56 (1H, s).

10 MS:m/e (ESI) 422.1 (MH⁺)

実施例 520

2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イ
ル)-1-(3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)-エタノン; 臭化水素
酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.34 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21
(2H, q, J=6.8Hz), 4.37 (2H, s), 4.79 (2H, s), 5.41 (2H, s), 6.97 (1H, d, J=8.4Hz), 7.33 (1H, s),
7.85 (1H, d, J=8.4Hz), 7.88 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 427.1 (MH⁺)

20 実施例 521

2-(3-クロロ-2-ジエチルアミノ-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン
-6-イル)-1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-エタノン; 臭化水素酸
塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.15 (6H, t, J=7.2Hz), 1.42 (18H, s), 3.51 (4H, q, J=7.2Hz), 4.73 (2H, s), 5.54 (2H, s),
7.77 (2H, s), 8.20 (1H, s), 9.51 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 485. 2 (MH⁺)

実施例 522

{8-第3ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸; 臭化

5 水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 30 (3H, t, J=7.6Hz), 1.35 (9H, s), 2.93 (2H, q, J=7.6Hz), 3.47 (2H, br), 4.01 (2H, s), 4.27 (2H, br), 4.81 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.06 (1H, s), 7.23 (1H, s), 7.70 (1H, d, J=8.0Hz), 8.15 (1H, d, J=8.0Hz).

10 MS: m/e (ESI) 451. 1 (MH⁺)

実施例 523

7-シアノ-2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.44 (18H, s), 2.86 (3H, d, J=4.4Hz), 5.17 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.76 (2H, s), 8.69 (1H, d, J=1.2Hz), 8.88 (1H, m), 9.05 (1H, d, J=1.2Hz).

実施例 524

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.34-1.46 (21H, m), 3.87 (3H, s), 4.22 (2H, q, J=7.0Hz), 4.77 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.75 (2H, s), 9.03 (1H, brs).

25 実施例 525

{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1,3-ジヒド

ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ)-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 30-1. 48 (12H, m), 3. 86 (3H, s), 4. 22 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 4. 88 (2H, s), 5. 4
9 (2H, s), 7. 07 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 33 (1H, s), 7. 82-7. 90 (2H, m), 9. 08 (1H, brd), 9. 45 (brs).

MS:m/e (ESI) 473. 1 (MH⁺)

実施例 526

2-{3-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-2-メチル-プロパン酸 メチルエステル;臭化

水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 388 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 529 (6H, s), 2. 810 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 570 (3H, s), 4. 257 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 852 (2H, s), 5. 475 (2H, s), 7. 487 (1H, s), 7. 54-7. 68 (2H, m), 7. 857 (1H, s), 7. 91 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 239 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 498 (1H, s).

実施例 527

{2-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ)-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34 (9H, s), 1. 40 (2H, t, J=7. 1Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 7Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 1Hz), 4. 37 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 42 (2H, s), 7. 27 (1H, t, J=8. 0Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 64 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 79 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 20 (1H, brq, J=4. 7Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 40 (1H, brd), 9. 94 (1H, brd).

MS:m/e (ESI) 482. 2 (MH⁺)

実施例 528

{2-第3ブチル-6-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ)-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=6.9Hz), 1.32-1.46 (12H, m), 4.11 (2H, q, J=6.9Hz), 4.22 (2H, q, J=6.7Hz)
4.38 (2H, s), 4.82 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.27 (1H, t, J=5.2Hz), 7.32 (1H, s), 7.63 (1H,
d, J=5.2Hz), 7.80 (1H, d, J=5.2Hz), 9.11 (1H, brs), 9.45 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 487.2 (MH⁺)

実施例 529

3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-安息香酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1.38 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.2Hz), 2.83 (3H, d, J=4.8Hz), 3.88 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=
7.2Hz), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.54 (1H, s), 7.98 (1H, d, J=2.0Hz), 8.15 (1H, d, J=2
.4Hz), 8.16-8.22 (1H, m), 8.56 (1H, s), 9.19 (1H, brs), 9.87 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 482.3 (MH⁺)

実施例 530

15 3-第3ブチル-2-カルボキシメトキシ-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカル
バモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-安息香酸 メチルエ
ステル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.39 (3H, t, J=7.2Hz), 1.41 (9H, s), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 3.88 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=
7.2Hz), 4.55 (2H, s), 4.85 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.54 (1H, s), 8.04 (1H, d, J=2.4Hz), 8.
16 (1H, d, J=3.0Hz), 8.18-8.23 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.26 (1H, brs), 9.89 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 540.3 (MH⁺)

実施例 531

25 {3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ}-酢酸;トリ
フルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 88 (3H, s), 3. 96 (2H, d, J=5. 6Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85 (2H, brs), 5. 50 (2H, brs), 7. 54 (1H, s), 7. 93 (1H, s), 8. 18-8. 22 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 8. 81 (1H, t, J=5. 6Hz), 9. 23 (1H, s), 9. 86 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 539. 3 (MH⁺)

実施例 532

(3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシベンゾイル)-メチル-アミノ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36, 1. 38 (9H, each, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 92, 3. 08 (3H, each, s), 3. 78, 3. 88 (3H, each, s), 3. 82, 3. 92 (2H, each, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85 (2H, brs), 5. 51 (2H, brs), 7. 54 (1H, brs), 7. 74 (1H, brs), 7. 91 (1H, brs), 8. 55 (1H, brs), 8. 18-8. 22 (1H, m), 9. 24 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

15 MS:m/e (ESI) 553. 4 (MH⁺)

実施例 533

5-(2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ)-ペンタン酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 67-1. 88 (4H, m), 2. 31 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 13 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 17 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 84 (1H, s), 7. 90 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 20 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 24 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs), 12. 05 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 524. 2 (MH⁺)

25 実施例 534

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-

イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 20 (2H, m), 4. 18 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 36 (2H, s), 7. 12 (1H, d, J=12. 0Hz),
7. 18 (1H, s), 7. 64 (2H, s).

5 MS:m/e (ESI) 441. 2 (MH⁺)

実施例 535

{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢
酸;トリフルオロ酢酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 82-1. 93 (4H, m), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 04-3.
18 (4H, m), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 40 (2H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 41 (1H, s),
7. 48 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 13-8. 25 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 15 (1H, brs), 9. 83 (1H, br
s).

15 MS:m/e (ESI) 551. 4 (MH⁺)

実施例 536

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸;トリ
フルオロ酢酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 34-1. 43 (12H, m), 1. 83-1. 92 (4H, m), 3. 07-3. 16 (4H, m), 4. 11
(2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 39 (
1H, s), 7. 46 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 556. 2 (MH⁺)

25 実施例 537

{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]

ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 04-1. 14 (4H, m), 1. 38 (9H, s), 1. 82-1. 94 (4H, m), 2. 27-2. 36 (1H, m), 3. 03-3. 18 (4H, m), 4. 40 (2H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 41 (1H, s), 7. 48 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 08 (1H, d, J=8. 0Hz).

MS:m/e (ESI) 491. 3 (MH⁺)

実施例 538

- 10 {4-第 3 ブチル-2-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-インゾインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ-酢酸;塩酸塩}

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 25 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 7Hz), 2. 82 (3H, brs), 4. 27 (2H, q, J=6. 7Hz), 4. 86 (2H, s), 4. 91 (2H, s), 5. 37 (2H, s), 7. 14 (1H, d, J=9. 0Hz), 7. 50 (1H, s), 7. 69 (1H, brd, J=9. 0Hz), 7. 83 (1H, s), 8. 20 (1H, brq, J=4. 0Hz), 9. 32 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

- 15 MS:m/e (ESI) 482. 2 (MH⁺)

実施例 539

{4-第 3 ブチル-2-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロインゾインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ-酢酸;塩酸塩}

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 24-1. 32 (12H, m), 1. 39 (3H, t, J=6. 7Hz), 4. 12 (2H, q, J=6. 7Hz), 4. 22 (2H, q, J=6. 7Hz), 4. 82 (2H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 37 (2H, s), 7. 14 (1H, d, J=8. 3Hz), 7. 31 (1H, s), 7. 69 (1H, dd, J=8. 3, 2. 8Hz), 7. 83 (1H, d, J=2. 8Hz), 9. 02 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 487. 1 (MH⁺)

実施例 540

- 25 1-(3, 5-ジ第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-[2-エチル-7-イミノ-3-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシメチル)-5, 7-ジヒドロ-ピロリジン-6-

イル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 30 (3H, t, J=7. 3Hz), 1. 30-1. 80 (6H, m), 1. 42 (18H, s), 2. 93 (2H, q, J=7. 3Hz), 3. 47-3. 55 (1H, m), 3. 75-3. 82 (1H, m), 4. 69 (1H, d, J=13. 6Hz), 4. 78-4. 81 (1H, m), 4. 86 (2H, s), 4. 90 (1H, d, J=13. 6Hz), 5. 55 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 21 (1H, s), 9. 75-9. 82 (1H, m).

実施例 541

1-(3,5-ジ第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(2-エチル-3-ヒドロキシメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

- 10 ¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 04 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 42 (18H, s), 2. 87 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 72 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 59 (2H, s), 7. 78 (2H, s), 8. 07 (1H, brs), 8. 21 (1H, s), 9. 53 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 75 (1H, d, J=8. 0Hz).

実施例 542

- 15 3-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-プロパン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 165 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 371 (9H, s), 1. 411 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 67-2. 73 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 96-3. 02 (2H, m), 3. 799 (3H, s), 4. 058 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 278 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 147 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 851 (2H, s), 5. 505 (2H, s), 7. 542 (1H, s), 7. 77 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 838 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 206 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 558 (1H, s).

実施例 543

- 25 3-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-プロパン酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 371 (9H, s), 1. 402 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 630 (2H, t, J=7. 6Hz), 2. 814 (3H, d, J=3. 2Hz),
2. 93-2. 99 (2H, m), 3. 802 (3H, s), 4. 267 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 838 (2H, s), 5. 600 (2H, s),
7. 522 (1H, s), 7. 785 (1H, s), 7. 848 (1H, s), 8. 204 (1H, s), 8. 215 (1H, s), 8. 573 (1H, s),
10. 033 (1H, d, J=8. 4Hz), 12. 262 (1H, s).

実施例 544

2-[2-(8-第3ブチル-4-カルバモイルメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジンは-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イン
ソール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 51 (2H, t, J=4. 0Hz), 3. 90
(2H, s), 4. 31 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 34 (2H, t, J=4. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 02 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 12 (1H, s), 7. 27 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 50 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 22 (1H, s), 9. 81 (1H, s).

15 実施例 545

2-[2-(3-第3ブチル-5-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル)-2-オキシ-エチル]-6-
エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インソール-5-カルボン酸メチルアミ
ド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 38 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 85 (3H, d, J=5. 0Hz), 3. 90 (3H, s),
4. 29 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 41 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 45 (1H, d,
J=2. 0Hz), 7. 55 (1H, s), 8. 22 (1H, q,
J=5. 0Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 32 (1H, brs), 9. 91 (1H, brs), 10. 03 (1H, s).

実施例 546

- 25 {3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ
-イソインドル-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェノキシ}-酢酸;トリフルオ

ロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 1. 47 (9H, s), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 3. 98 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 82 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 44 (1H, d, J=2Hz), 7. 56 (1H, s), 7. 58 (1H, d, J=2Hz), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 59 (1H, s), 9. 25 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

実施例 547

2-[2-[3-第 3 ブチル-4-(2H-テトラゾール-5-イルメトキシ)-フェニル]-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
メチルアミド;塩酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 32 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 5. 64 (2H, s), 7. 00 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 33-7. 45 (2H, m), 7. 53 (1H, s), 7. 86 (1H, s), 7. 94 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 20 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 25 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

15 MS:m/e (ESI) 506. 2 (MH⁺)

実施例 548

2-[2-[3-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸
エチルエステル;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 24 (3H, t, J=6. 4Hz), 1. 31-1. 50 (12H, m), 1. 78-1. 99 (4H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 02-3. 17 (4H, m), 4. 22-4. 40 (4H, m), 4. 49 (2H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 13-8. 28 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 14 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

25 MS:m/e (ESI) 579. 3 (MH⁺)

実施例 549

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸 エチ
ルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 23 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 29 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 33-1. 48 (12H, m), 1. 82-1. 94 (4H, m), 3
. 04-3. 16 (4H, m), 4. 11 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 15-4. 30 (4H, m), 4. 49 (2H, s), 4. 78 (2H, s),
5. 48 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 48 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 584. 3 (MH⁺)

実施例 550

- 10 2-[2-(3,5-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-7-フルオロ
-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水
素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 44 (18H, s), 2. 85 (3H, d, J=4.4Hz), 5. 05 (2H, s), 5. 65 (2H, s), 7. 79 (2H, s), 8. 13 (1H,
dd, J=1.3, 9.5Hz), 8. 69 (1H, d, J=1.3Hz), 8. 77 (1H, m).

実施例 551

{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸;トリ
フルオロ酢酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 70-2. 08 (4H, m), 2. 88-3. 21 (4H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 39 (2H
, s), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 47 (1H, s), 9. 07 (1H, brs),
9. 29 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 528. 1 (MH⁺)

- 25 実施例 552

{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ

インドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル)-
酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 31 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 3. 50 (2H, t, J=4. 4Hz), 4. 13
(2H, q, J=7. 2Hz), 4. 16 (2H, s), 4. 22 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 31 (2H, t, J=4. 4Hz), 4. 79 (2H,
s), 5. 44 (2H, s), 7. 06 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 26 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 33 (1H, s), 9. 02 (1H, s
) , 9. 35 (1H, s), 12. 71 (1H, s).

実施例 553

- 10 {8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]オキサジン-4-
イル)-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 33 (3H, s), 2. 60 (3H, s), 3. 50 (2H, t, J=4. 4Hz), 4
. 01 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 16 (2H, s), 4. 31 (2H, t, J=4. 4Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7.
07 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 28 (1H, d, J=1. 6Hz), 9. 45 (1H, s), 9. 84 (1H, s), 12. 71 (1H, s).

実施例 554

- 20 2-[2-(8-第3ブチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキ
ソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン
酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 36 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 36 (2H, t, J=4. 4Hz), 4. 23
(2H, t, J=4. 4Hz) 4. 29 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 14 (1H, d, J=2. 0Hz
) , 7. 18 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 28 (1H, s)
, 9. 88 (1H, s).

実施例 555

{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ

インドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジンを-4-イル)-
酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35 (9H, s), 3. 48 (2H, brs), 3. 86 (2H, s), 3. 95 (2H, s), 4. 12 (2H, s), 4. 28 (2H, brs), 4.
5 78 (2H, s), 5. 42 (2H, s), 7. 04 (1H, s), 7. 24 (1H, s), 7. 34 (1H, s).
MS:m/e (ESI) 500. 1 (MH⁺)

実施例 556

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-6-メ
トキシ-5-プロポキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノール;塩酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 00 (3H, t, J=7. 1Hz), 1. 41 (18H, s), 1. 75-1. 86 (2H, m), 3. 87 (3H, s), 4. 12 (2H, t, J=6.
4Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 75 (2H, s).

実施例 557

{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-5-プロポキシ-1,3-ジヒ
15 ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 99 (3H, t, J=7. 5Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 72-1. 86 (2H, m), 3. 87 (3H, s), 4. 11 (2H, t, J=6. 4
Hz), 4. 78 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 07 (1H, d, J=8. 1Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 78-
7. 92 (2H, m), 9. 06 (1H, brs).

- 20 実施例 558

2-[2-(3,3-ジメチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-2-オキソ-
エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 30 (6H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85
(2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 03 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 52 (1H, s), 7. 90 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 97 (

1H, s), 8.16-8.24 (1H, m), 8.56 (1H, s), 10.90 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 435.0 (MH⁺)

実施例 559

5 6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-オキシ-2-(1,3,3-トリメチル-2-オキシ-2,3-ジヒドロ-1H-インドル-5-イル)-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.30-1.43 (9H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.19 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=7.2Hz), 4.85 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.20-7.24 (1H, m), 7.52-7.54 (1H, m), 7.98-8.02 (2H, m), 8.17-8.21 (1H, m), 8.56 (1H, s).

10

MS:m/e (ESI) 449.1 (MH⁺)

実施例 560

15 5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2-オキシ-2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル]-酢酸;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.34 (6H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz), 4.53 (2H, s), 4.86 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.24 (1H, d, J=8.0Hz), 7.58 (1H, s), 7.97 (1H, d, J=8.0Hz), 8.03 (1H, s), 8.17-8.25 (1H, m), 8.56 (1H, s), 9.25 (1H, brs), 9.85 (1H, brs).

20

MS:m/e (ESI) 493.1 (MH⁺)

実施例 561

25 2-{3-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-2-メチル-プロパン酸;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.410 (3H, t, J=6.8Hz), 1.514 (9H, s), 2.823 (3H, d, J=4.8Hz), 4.279 (2H, q, J=6.8Hz), 4.869 (2H, s), 5.525 (2H, s), 7.539 (1H, s), 7.582 (1H, t, J=7.6Hz), 7.716 (1H, d, J=8.4

Hz), 7.913 (1H, d, J=8.4Hz), 7.924 (1H, s), 8.205 (1H, q, J=4.8Hz), 8.563 (1H, s).

実施例 562

4-{3-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-4-メチル-2-ペンテン酸 エチルエステル;臭

5 化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.182 (3H, t, J=7.2Hz), 1.405 (3H, t, J=7.2Hz), 1.482 (6H, s), 2.817 (3H, d, J=4.8Hz), 4.09
8 (2H, q, J=7.2Hz), 4.274 (2H, q, J=7.2Hz), 4.868 (2H, s), 5.529 (2H, s), 5.821 (1H, d, J
=15.6Hz), 7.026 (1H, d, J=15.6Hz), 7.539 (1H, s), 7.592 (1H, t, J=7.6Hz), 7.713 (1H, d
10 , J=8.0Hz), 7.900 (1H, s), 7.931 (1H, d, J=8.0Hz), 8.206 (1H, q, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s)

実施例 563

4-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-4-メチル-2-ペンテン酸 エチルエステル;臭化水

15 素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.184 (3H, t, J=7.2Hz), 1.285 (3H, t, J=6.8Hz), 1.390 (3H, t, J=6.8Hz), 1.482 (6H, s),
4.06-4.14 (4H, m), 4.208 (2H, q, J=7.2Hz), 4.817 (2H, s), 5.511 (2H, s), 5.821 (1H, d, J
=15.6Hz), 7.028 (1H, d, J=15.6Hz), 7.335 (1H, s), 7.56-7.61 (1H, m), 7.705 (1H, d, J=8
20 .0Hz), 7.87-7.91 (2H, m).

実施例 564

2-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-2-メチル-プロパン酸 メチルエステル;臭化水素

酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.284 (3H, t, J=7.2Hz), 1.390 (3H, t, J=6.8Hz), 1.548 (6H, s), 3.590 (3H, s), 4.110 (2H

, q, J=6.8Hz), 4.208(2H, t, J=7.2Hz), 4.820(2H, s), 5.517(2H, s), 7.341(1H, s), 7.55-7.70(2H, m), 7.85-7.94(2H, m).

実施例 565

5 2-[3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール
-2-イル)-アセチル]-フェニル]-2-メチル-プロパン酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

1.282(3H, t, J=6.8Hz), 1.387(3H, t, J=6.8Hz), 1.514(6H, s), 4.106(2H, q, J=6.8Hz),
 4.205(2H, q, J=6.8Hz), 4.818(2H, s), 5.521(2H, s), 7.23-7.42(2H, m), 7.579(1H, t, J
 =8.0Hz), 7.705(1H, d, J=8.0Hz), 7.86-7.93(2H, m).

10 実施例 566

8-第 3 ブチル-6-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン
-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イルメチレン-シ
アナミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

15 1.37(9H, s), 2.70(3H, s), 4.05(2H, t, J=5Hz), 4.39(2H, t, J=5Hz), 5.04(2H, s) 6.33(2
 H, s), 7.49(1H, d, J=8Hz), 7.86(1H, d, J=8Hz), 7.87(1H, d, J=8Hz), 8.43(1H, d, J=8Hz)
 , 9.70(1H, s).

MS:m/e(ESI) 431.0(MH⁺)

実施例 567

20 2-[2-(8-第 3 ブチル-4-シアノイミノメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキ
サジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イン
インドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

25 1.36(9H, s) 1.40(3H, t, J=7Hz), 2.83(3H, d, J=5Hz), 4.00(2H, t, J=5Hz), 4.28(2H, q, J
 =7Hz), 4.44(2H, t, J=5Hz), 4.82(2H, s), 5.40(2Hs),
 7.51(1H, s), 7.70(1H, d, J=2Hz), 8.19(1H, d, J=2Hz), 8.20(1H, s), 8.52(1H, s), 9.44(

1H, s).

MS:m/e (ESI) 517. 0 (MH⁺)

実施例 568

5 8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジノ-4-イルメ
チレン-シアナミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7Hz), 4. 00 (2H, t, J=5Hz), 4. 12 (2H, q,
J=7Hz), 4. 21 (2H, q, J=7Hz), 4. 43 (2H, t, J=5Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 32 (1H, s)
10), 7. 70 (1H, d, J=2Hz), 8. 17 (1H, d, J=2Hz), 9. 43 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 522. 0 (MH⁺)

実施例 569

4-{3-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインド
ール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-4-メチル-2-ペンテン酸;塩酸塩

15 1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 401 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 472 (6H, s), 2. 814 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 268 (2H, q, J=6. 8Hz),
4. 862 (2H, s), 5. 565 (2H, s), 5. 745 (1H, d, J=16. 0Hz), 6. 969 (1H, d, J=16. 0Hz), 7. 528 (1H, s),
7. 586 (1H, t, J=8. 0Hz), 7. 69-7. 73 (1H, m), 7. 89-7. 92 (1H, m), 8. 209 (1H, q, J=4. 8Hz),
8. 559 (1H, s), 9. 388 (1H, s).

20 実施例 570

4-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール
-2-イル)-アセチル]-フェニル}-4-メチル-2-ペンテン酸;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 284 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 389 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 472 (6H, s), 4. 109 (2H, q, J=6. 8Hz),
4. 207 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 817 (2H, s), 5. 545 (2H, s), 5. 745 (1H, d, J=16. 0Hz), 6. 970 (1H, d, J=16. 0Hz),
25 7. 332 (1H, s), 7. 582 (1H, t, J=8. 0Hz), 7. 69-7. 73 (1H, m), 7. 8707. 92 (

2H, m), 9.081 (1H, s), 9.466 (1H, s).

実施例 571

2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メチルアミノメチルフェニル)-2-オキシ-
エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1.37-1.42 (12H, m), 2.578 (3H, d, J=2.8Hz), 2.806 (3H, d, J=4.4Hz), 4.258 (2H, q, J=6.8Hz), 4.277 (2H, s), 4.843 (2H, s), 5.567 (2H, s), 7.513 (1H, s), 7.861 (1H, d, J=2.4Hz), 8.154 (1H, s), 8.207 (1H, q, J=4.4Hz), 8.559 (1H, s), 9.248 (1H, s), 9.559 (1H, s), 10.001 (1H, s), 10.227 (1H, s).

実施例 572

1-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-メチルアミノメチルフェニル)-2-(5,6-ジエ
トキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;
塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1.298 (3H, t, J=6.8Hz), 1.385 (3H, t, J=6.8Hz), 1.396 (9H, s), 2.575 (3H, s), 4.101 (2H, q, J=6.8Hz), 4.201 (2H, q, J=6.8Hz), 4.269 (2H, s), 4.798 (2H, s), 5.519 (2H, s), 7.321 (1H, s), 7.852 (1H, d, J=1.6Hz), 8.092 (1H, s), 9.080 (1H, s), 9.494 (1H, s), 10.179 (1H, s).

実施例 573

N-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-コハク酸 エチルエステル;臭
化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1.16 (3H, t, J=6.8Hz), 1.33 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 2.56 (2H, d, J=5.6Hz), 2.58 (3H, d, J=5.6Hz), 2.80 (3H, d, J=6.4Hz), 4.04 (2H, q, J=6.8Hz), 4.25 (2H, q, J=6.8Hz),

4. 85 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 29 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 84 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 98 (1H, s), 8. 19 (1H, q, J=5. 2Hz), 8. 56 ((1H, s), 9. 44 (1H, s), 9. 98 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 551. 4 (MH⁺)

実施例 574

- 5 N-(2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル)-N-メチル-コハク酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 13 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 35 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 13-2. 22 (4H, m), 2. 81 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 08 (3H, s), 3. 98 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 26 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 13 (2H, s), 5. 49 (3H, s), 7. 23 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 51 (1H, s), 7. 94 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 17-8. 21 (2H, m), 8. 52 (1H, brs).

実施例 575

- 15 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メトキシ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (3H, t, J=8. 0Hz), 1. 41 (18H, s), 4. 03 (3H, s), 4. 18 (2H, q, J=8. 0Hz), 4. 73 (2H, s), 4. 45 (2H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 73 (2H, s).

実施例 576

- 20 1-(3-第3ブチル-4-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 38 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (9H, s), 1. 88-1. 95 (4H, m), 2. 90-2. 98 (4H, m), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 20 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 32 (1H, s), 7. 65 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 88 (dd, J=8. 4, 2. 0Hz), 7. 92 (1H, d, J=2. 0Hz).

実施例 577

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸 第3ブチル エステル;臭
化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 28 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 39 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 40 (18H, s), 4. 05 (2H, d, J=6.0Hz), 4. 1
1 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 20 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 75 (2H, s), 5. 36 (2H, s), 5. 87 (1H, t, J=6.0H
z), 6. 53 (1H, d, J=8.4Hz), 7. 30 (1H, s), 7. 71 (1H, dd, J=8.4, 2.0Hz), 7. 77 (1H, d, J=2.0
Hz).

実施例 578

- 10 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 40 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 40 (9H, s), 4. 09 (2H, brs), 4. 11 (2H, q,
J=7.2Hz), 4. 20 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 38 (2H, s), 6. 57 (1H, d, J=8.8Hz), 7. 3
2 (1H, brs), 7. 72 (1H, dd, J=8.8, 2.0Hz), 8. 48-9. 03 (1H, m), 9. 30-9. 35 (1H, m).

実施例 579

1-(8-第3ブチル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イ
ル)-2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イン
ドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 92 (3H, s), 3. 89 (3H, s), 4. 24 (2H, q, J=6.8Hz), 4
. 36 (2H, t, J=4.4Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 28 (1H, s), 7. 35 (1H, s)
, 9. 08 (1H, s), 9. 26 (1H, s).

実施例 580

- 25 2-[2-(8-第3ブチル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イ
ル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-7-フルオロ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イン

インドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 2.84 (3H, d, J=4.8Hz), 2.93 (3H, s), 4.32 (2H, q, J=6.8Hz), 4.36 (2H, t, 4.4Hz), 5.01 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.19 (1H, d, J=2.0Hz), 7.29 (1H, d, J=2.0Hz), 8.30 (1H, s), 8.41 (1H, q, J=4.8Hz), 9.47 (1H, s), 10.02 (1H, s).

実施例 581

2-[2-(3-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキシエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 43 (3H, t, J=6.8Hz), 2.84 (3H, d, J=4.4Hz), 3.10 (6H, s), 4.29 (2H, q, J=6.8Hz), 4.87 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.25 (1H, d, J=8.4Hz), 7.55 (1H, s), 7.93 (1H, m), 8.23 (2H, m), 8.58 (1H, s), 9.46 (1H, s), 9.95 (1H, s).

実施例 582

15 1-(3,5-ジ第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5-イソプロポキシ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロ-インソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 34 (6H, d, J=6.0Hz), 1.40 (18H, s), 3.85 (3H, s), 4.74-4.85 (3H, m), 5.47 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.75 (2H, s).

実施例 583

[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5-イソプロポキシ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロ-インソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 34 (6H, d, J=6.0Hz), 1.39 (9H, s), 3.84 (3H, s), 4.72-4.85 (3H, m), 4.88 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.07 (1H, d, J=7.9Hz), 7.82-7.92 (2H, m).

MS: m/e (ESI) 487. 2 (MH⁺)

実施例 584

{8-第3ブチル-6-[2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34 (9H, s), 1. 38 (3H, t, J=7. 0Hz), 3. 48 (2H, brs), 3. 86 (3H, s), 4. 14 (2H, s), 4. 20 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 28 (2H, brs), 4. 76 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 03 (1H, s), 7. 23 (1H, s), 7. 32 (1H, s), 9. 03 (1H, brs).

10 実施例 585

{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-5-プロボキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 0. 98 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 74-1. 85 (2H, m), 3. 48 (2H, brt, J=4. 3Hz), 3. 86 (3H, s), 4. 08-4. 18 (4H, m), 4. 28 (2H, brt, J=4. 3Hz), 4. 77 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 04 (1H, s), 7. 23 (1H, s), 7. 32 (1H, s), 9. 03 (1H, brs).

実施例 586

1-(8-第3ブチル-4-エチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 09 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 30 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 34 (9H, s), 2. 94 (2H, q, J=7. 6Hz), 3. 35 (2H, t, J=4. 4Hz), 3. 40 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 27 (2H, t, J=4. 4Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 19 (1H, s), 7. 21 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 17 (1H, d, J=8. 0Hz).

MS: m/e (ESI) 421. 2 (MH⁺)

実施例 587

1-(8-第 3 ブチル-4-プロピル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

0.90 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1.30 (3H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 1.34 (9H, s), 1.52-1.62 (2H, m), 2.94 (2H, q, $J=7.6\text{Hz}$), 3.27 (2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 3.38 (2H, t, $J=4.4\text{Hz}$), 4.25 (2H, t, $J=4.4\text{Hz}$), 4.84 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.15 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.21 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.72 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 8.17 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$).

10 MS: m/e (ESI) 435.2 (MH $^+$)

実施例 588

1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-ビペリジン-2-オン;臭化水素酸塩

15 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1.26 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1.34 (9H, s), 1.68 (4H, br), 2.32 (2H, br), 2.86 (2H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 3.25-3.40 (2H, m), 4.40 (2H, s), 4.53 (2H, s), 5.12 (2H, s), 7.48 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.77 (1H, br), 7.82 (1H, br), 7.96 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$).

MS: m/e (ESI) 463.2 (MH $^+$)

20 実施例 589

N-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-N-メチル-アセトアミド;トリフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1.30 (3H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 1.37 (9H, s), 2.11 (3H, s), 2.94 (2H, q, $J=7.6\text{Hz}$), 3.10 (3H, s), 4.48 (2H, s), 4.86 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.73 (1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 7.81 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.

90 (1H, d, J=2.0 Hz), 8.17 (1H, d, J=8.2 Hz), 9.52 (1H, s), 9.85 (1H, s), 11.28 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 437.2 (MH⁺)

実施例 590

5 {2-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-6-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミ
ノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢
酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.31 (3H, t, J=7.6 Hz), 1.40, 1.41 (9H, each s), 2.02, 2.10 (3H, each
s), 2.80, 2.94 (3H, each s), 2.92-2.97 (2H, m), 4.49, 4.52 (2H, each
10 s), 4.62, 4.70 (2H, each s), 4.86, 5.55 (2H, each s), 7.49, 7.53 (1H, each
s), 7.74 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.84, 7.89 (1H, each
s), 8.18 (1H, d, J=8.0 Hz), 9.52 (1H, brs), 9.89 (1H, brs).

実施例 591

15 {2-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-6-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イ
ミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-
フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.39 (3H, t, J=6.8 Hz), 1.40 (9H, s), 2.01, 2.09 (3H, each s), 2.31 (3H, s), 2.58,
2.79 (3H, each s), 2.93, 3.14 (3H, each s), 3.98 (2H, q, J=7.2 Hz), 4.48,
20 4.52 (2H, each s), 4.61, 4.69 (2H, each s), 4.82 (2H, s), 5.52, 5.54 (2H, each s),
7.47, 7.51 (1H, each d, J=2.0 Hz), 7.83, 7.88 (1H, each d, J=2.0 Hz), 9.43 (1H, s),
9.88 (1H, s).

実施例 592

25 {8-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]
ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢
酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 00-1. 19 (4H, m), 1. 35 (9H, s), 2. 23-2. 36 (1H, m), 4. 14 (2H, s), 4. 20-4. 37 (2H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 04 (1H, s), 7. 25 (1H, s), 7. 70 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 07 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 52 (1H, brs), 9. 58-9. 63 (1H, m).

5 MS: m/e (ESI) 463. 2 (MH⁺)

実施例 593

6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-オキシ-2-(1, 2, 3, 3-テトラメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インドル-5-イル)-エチル]-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 02 (3H, s), 1. 15 (3H, d, J=6. 4Hz), 1. 27 (3H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 80 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 19 (1H, q, J=3. 4Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 35 (2H, s), 6. 60 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 52 (1H, s), 7. 60 (1H, s), 7. 77 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 20 (1H, d, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, brs).

15 MS: m/e (ESI) 449. 2 (MH⁺) 2

実施例 594

2-[2-(5-第 3 ブチル-フラン-3-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 28 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 29 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 24 (2H, s), 6. 48 (1H, d, J=0. 8Hz), 7. 54 (1H, s), 8. 22 (1H, m), 8. 58 (1H, s), 8. 63 (1H, d, J=0. 8Hz).

実施例 595

[2, 6-ジ第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-アセチル]-フェノキシ-酢酸;塩酸塩

25

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39-1. 42 (3H, m), 1. 404 (18H, s), 2. 818 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 266 (2H, s), 4. 272 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 847 (2H, s), 5. 572 (2H, s), 7. 534 (1H, s), 7. 891 (2H, s), 8. 214 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 554 (1H, s), 9. 309 (1H, s), 9. 309 (1H, s), 9. 913 (1H, s).

実施例 596

- 5 1,2,6-ジ第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 285 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 34-1. 45 (21H, s), 4. 110 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 209 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 262 (2H, s), 4. 796 (2H, s), 5. 555 (2H, s), 7. 333 (1H, s), 7. 878 (2H, s), 9. 085 (1H, s), 9. 412 (1H, s).

10

実施例 597

1-{3-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-シクロペンタンカルボン酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 386 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 50-1. 77 (6H, m), 2. 37-2. 50 (2H, m), 2. 806 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 256 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 919 (2H, s), 4. 97-5. 04 (1H, m), 7. 15-7. 42 (4H, m), 7. 478 (1H, s), 8. 14-8. 21 (1H, m), 8. 534 (1H, s).

15

実施例 598

1-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-シクロペンタンカルボン酸;塩酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 264 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 379 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 55-1. 77 (6H, m), 2. 43-2. 50 (2H, m), 4. 075 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 188 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 879 (2H, s), 4. 95-5. 02 (1H, m), 7. 23-7. 40 (5H, m).

25

実施例 599

1-{3-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-シクロペンタンカルボン酸;塩酸塩

ール-2-イル)-アセチル]-フェニル)-シクロペンタンカルボン酸 エチルエステル;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 079 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 408 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 60-1. 74 (4H, m), 1. 83-1. 94 (2H, m),
2. 52-2. 60 (2H, m), 2. 821 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 016 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 276 (2H, q, J=6. 8
Hz), 4. 871 (2H, s), 5. 520 (2H, s), 7. 52-7. 72 (2H, m), 7. 884 (1H, s), 7. 924 (1H, d, J=7. 6
Hz), 8. 215 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 554 (1H, s).

実施例 600

- 10 1-{3-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール
-2-イル)-アセチル]-フェニル}-シクロペンタンカルボン酸 エチルエステル;臭
化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 079 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 287 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 393 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 60-1. 74 (4H
, m), 1. 84-1. 94 (2H, m), 2. 52-2. 60 (2H, m), 4. 016 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 113 (2H, q, J=7. 2
Hz), 4. 211 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 822 (2H, s), 5. 504 (2H, s), 7. 339 (1H, s), 7. 582 (1H, t, J
=8. 0Hz), 7. 691 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 877 (1H, s), 7. 911 (1H, d, J=7. 6Hz).

実施例 601

- 20 6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-オキソ-2-(1, 3, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-イン
ドール-5-イル)-エチル]-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチ
ルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 27 (6H, s) 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 86 (3H, s), 3. 28 (2H, s), 4.
28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 32 (2H, s), 6. 57 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 51 (1H, s), 7. 5
9 (1H, s), 7. 76 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 17-8. 23 (1H, m), 8. 54 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 72 (1H, brs).

実施例 602

1-[3-第3ブチル-4-(2H-テトラゾール-5-イルメトキシ)-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;

塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 26-1. 43 (15H, m), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 5. 63 (2H, s), 6. 94-7. 06 (1H, m), 7. 31-7. 45 (3H, m), 9. 04 (1H, brs), 9. 33 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 511. 2 (MH⁺)

実施例 603

- 10 2-[2-(8-第3ブチル-4-カルバモイルメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-7-フルオロ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 34 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 38 (9H, s), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 51 (2H, t, J=4. 4Hz), 3. 90 (2H, s), 4. 31 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 34 (2H, t, J=4. 4Hz), 5. 00 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 01 (1H, s), 7. 13 (1H, s), 7. 27 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 8. 30 (1H, s), 8. 41 (1H, q, J=4. 4Hz), 9. 47 (1H, s), 10. 02 (1H, s).

実施例 604

- 20 2-[8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル]-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 31 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 51 (2H, t, J=4. 4Hz), 3. 90 (2H, s), 4. 13 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 22 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 34 (2H, J=4. 4Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 00 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 13 (1H, s), 7. 26 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 9. 02 (1H, s), 9. 35 (1H, s).

実施例 605

2-[2-(3,5-ジメチル第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 29(18H, s), 1. 41(3H, t, J=7. 2Hz), 2. 83(3H, d, J=4. 4Hz), 2. 90(2H, t, J=7. 2Hz), 3. 9
3(2H, t, J=7. 2Hz), 4. 27(2H, q, J=7. 2Hz), 4. 75(2H, s), 6. 81(1H, s), 6. 92(2H, s), 7. 47
(1H, s), 8. 18(1H, q, J=4. 4Hz), 8. 56(1H, s), 9. 17(1H, s), 9. 71(1H, s).

実施例 606

- 10 1-[8-第3ブチル-4-(3-ヒドロキシプロピル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オ
キサジン-6-イル]-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン
-6-イル)-エタノール;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 31(3H, t, J=7. 4Hz), 1. 34(9H, s), 1. 71(2H, m), 2. 94(2H, q, J=7. 4Hz), 3. 26-3. 72(6H
, m), 4. 26(2H, t, J=4. 8Hz), 4. 85(2H, s), 5. 53(2H, s), 7. 21(2H, s), 7. 73(1H, d, J=8. 0Hz
z), 8. 17(1H, d, J=8. 0Hz), 9. 55(1H, s), 9. 85(1H, s).

MS:m/e(ESI) 451

実施例 607

- 20 2-[2-[8-第3ブチル-4-(3-ヒドロキシプロピル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]
オキサジン-6-イル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-
インドール-5-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

0. 90(3H, t, J=7. 2Hz) 1. 30(3H, t, J=7. 6Hz), 1. 34(9H, s), 1. 52-1. 62(2H, m), 2. 94(2H,
q, J=7. 6Hz) 3. 27(2H, t, J=7. 4Hz), 3. 38(2H, t, J=4. 4Hz), 4. 25(2H, t, J=4. 4Hz), 4. 84(
2H, s), 5. 54(2H, s), 7. 15(1H, d, J=2. 0Hz), 7. 21(1H, d, J=2. 0Hz), 7. 72(1H, d, J=8. 0Hz
), 8. 17(1H, d, J=8. 0Hz).

実施例 608

6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-オキシ-2-(1,4,4-トリメチル-2-オキシ-1,2,3,4-テ
トラヒドロキノリン-6-イル)-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カ
ルボン酸 メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 27 (6H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 54 (2H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 29 (2H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 32 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 89 (1H, s), 7. 95 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 18-8. 24 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 24 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs).

実施例 609

- 10 {2-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-6-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ
-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェ
ノキシ}-酢酸; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 39 (12H, s), 2. 01, 2. 10 (3H, each s), 2. 80, 2. 94 (3H, each s), 4. 11, 4. 22 (2H, each brd, J=6. 8Hz), 4. 48, 4. 52 (2H, each s), 4. 61, 4. 69 (2H, each s), 4. 80 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 48, 7. 51 (1H, each s), 7. 83, 7. 87 (1H, each s), 9. 06 (1H, s), 9. 32 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 572. 3 (MH⁺)

実施例 610

- 20 {2-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-6-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ
-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェ
ノキシ}-酢酸 メチルエステル; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 39 (12H, s), 2. 01, 2. 09 (3H, each s), 2. 80, 2. 94 (3H, each s), 3. 75, 3. 77 (3H, each s), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 06 (2H, s), 4. 64, 4. 68 (2H, each s), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 06 (2H, s), 4. 64, 4. 68 (2H, each s).

s), 4.79 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.47, 7.52 (1H, each s), 7.83, 7.87 (1H, each d, J=2.0Hz), 9.06 (1H, each s).

MS: m/e (ESI) 586.4 (MH⁺)

実施例 611

5 2-[2-(7-第3ブチル-2-シアノアミノ-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.08 (3H, t, J=7Hz), 1.44 (9H, s), 2.84 (3H, d, J=5Hz), 4.28 (2H, q, J=7Hz), 4.84 (2H, s),
10 , 5.52 (2H, s), 5.55 (1H, q, J=5Hz), 7.54 (1H, s), 7.64 (1H, s), 8.21 (1H, s), 8.56 (1H, s)

実施例 612

15 {8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.28-1.42 (12H, m), 2.78 (3H, d, J=4.5Hz), 3.48 (2H, brt, J=4.5Hz), 4.15 (2H, s), 4.24
(2H, q, J=7.0Hz), 4.30 (2H, brt, J=4.5Hz), 4.85 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.03 (1H, s), 7.2
20 5 (1H, s), 7.98 (1H, s), 8.54 (qH, brq, J=4.5Hz), 9.48 (1H, brd, J=7.0Hz), 9.93 (1H, brd
, J=7.0Hz).

実施例 613

25 1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(6-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-5-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.28 (3H, t, J=7.0Hz), 1.41 (18H, s), 3.95 (3H, s), 4.10 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s),

5. 48 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 07 (1H, brs), 9. 06 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

実施例 614

{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-

5 酢酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35 (9H, s), 3. 49 (2H, brs), 3. 64 (3H, s), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 25-4. 34 (3H, m),
4. 78 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 7. 03 (1H, s), 7. 24 (1H, s), 7. 35 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 514. 3 (MH⁺)

10 実施例 615

2-(8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロ
ロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン
-4-イル)-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 4Hz), 2. 33 (3H, s), 2. 60 (3H, s), 3. 51 (2H, s), 3. 90 (2H, s),
4. 00 (2H, q, J=6. 4Hz), 4. 35 (2H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 01 (1H, s), 7. 13 (1H,
s), 7. 27 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 9. 40 (1H, s), 9. 81 (1H, s).

実施例 616

{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-酢酸; 2 トリフ
ルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 38 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 41 (9H, s), 3. 79 (2H, brs), 4. 12 (2H, q,
J=7. 2Hz), 4. 23 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 25 (2H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 33 (1H, s),
25 7. 84 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 9. 07 (1H, s), 9. 37 (1H, s).

実施例 617

{6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-2-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-酢酸:塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 32 (6H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 57 (2H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 77 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 25 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 87-7. 94 (2H, m), 8. 17-8. 25 (1H, m), 8. 57 (1H, s), 9. 26 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 507. 3 (MH⁺)

実施例 618

- 10 1-(5-第 3 ブチル-フラン-3-イル)-2-(4-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (9H, s), 1. 35 (3H, t, J=7. 2Hz), 4. 20 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 22 (2H, s), 6. 48 (1H, d, J=0. 4Hz), 7. 41-7. 54 (2H, m) 8. 61 (1H, d, J=0. 4Hz).

- 15 実施例 619

1-(5-第 3 ブチル-フラン-3-イル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 29 (9H, s), 1. 31 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 4. 13 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 23 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 22 (2H, s), 6. 48 (1H, d, J=0. 8Hz), 7. 34 (1H, s), 8. 60 (1H, d, J=0. 8Hz), 9. 10 (1H, s), 9. 41 (1H, s).

実施例 620

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-イソプロポキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (6H, d, J=6.0Hz), 1. 41 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 85 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 67 (1H, m), 4. 86 (2H, s), 5. 48 (2H, s) 7. 49 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 22 (1H, m), 8. 59 (1H, s), 9. 24 (1H, s), 9. 87 (1H, s).

実施例 621

- 5 2-[2-(3-第 3 ブチル-5-シクロペンチルオキシ-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 58 (2H, m), 1. 73-2. 00 (6H, m), 2. 85 (3H, d, J=4. 4 Hz), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 4. 87 (1H, m), 5. 49 (2H, s), 7. 40 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 22 (1H, m), 8. 60 (1H, s), 9. 22 (1H, s), 9. 86 (1H, s).

実施例 622

- 15 [3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル]-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 167 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 373 (9H, s), 1. 409 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 822 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 757 (3H, s), 3. 819 (2H, s), 4. 102 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 277 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 856 (2H, s), 5. 494 (2H, s), 7. 536 (1H, s), 7. 846 (1H, s), 8. 215 (1H, s), 8. 204 (1H, s), 8. 551 (1H, s).

実施例 623

- 20 [3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル]-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 164 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 285 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 370 (9H, s), 1. 391 (3H, t, J=7. 2Hz),

3. 753 (3H, s), 3. 817 (2H, s), 4. 06-4. 14 (4H, m), 4. 207 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 803 (2H, s),
5. 469 (2H, s), 7. 344 (1H, s), 7. 832 (2H, s).

実施例 624

5 6-[2-(8-第 3 ブチル-4-メチル-3, 4-ジヒ ドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イ
ル)-2-オキシソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒ ドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピ
リジン-2-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 38 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 79 (3H, d, J=4. 0Hz), 2. 93 (3H, s), 3. 33 (2H, s), 4
26 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 36 (2H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 20 (1H, s), 7. 29 (1H, s)
10 , 8. 01 (1H, s), 8. 59 (1H, q, J=4. 0Hz), 9. 55 (1H, s), 9. 97 (1H, s).

実施例 625

15 6-[2-(8-第 3 ブチル-4-カルバモイルメチル-3, 4-ジヒ ドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキ
サジン-6-イル)-2-オキシソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒ ドロ-5H-ピロ
ロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 38 (12H, s), 2. 79 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 91 (2H, s), 4. 25 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 34 (2H, t, J
=4. 4Hz), 4. 89 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 02 (1H, s), 7. 14 (1H, s), 7. 27 (1H, s), 7. 55 (1H, s)
) , 8. 00 (1H, s), 8. 57 (1H, q, J=4. 8Hz), 9. 52 (1H, s), 9. 94 (1H, s).

実施例 626

20 {2-第 3 ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1, 3-ジヒ ドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸;トリ
フルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 83-1. 93 (4H, m), 3. 06-3. 16 (4H, m), 4. 27 (2H, q,
25 J=6. 8Hz), 4. 40 (2H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 41 (1H, s), 7. 48 (1H, s), 7. 54 (1H,
s), 7. 70 (1H, brs), 7. 79 (1H, brs), 8. 62 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 537. 3 (MH⁺)

実施例 627

{2-第 3 ブチル-4-[2-(6-ジメチルカルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ-}

5 酢酸; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 84-1. 93 (4H, m), 2. 78 (3H, s), 3. 00 (3H, s), 3. 08-3. 15 (4H, m), 4. 22 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 40 (2H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 48 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 8. 03 (1H, s), 9. 13 (1H, brs), 9. 69 (1H, brs).

10 MS: m/e (ESI) 565. 4 (MH⁺)

実施例 628

{2-第 3 ブチル-4-[2-(6-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-5-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ-酢酸; 塩酸塩}

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 28 (3H, t, J=6. 7Hz), 1. 40 (9H, s), 3. 93 (3H, s), 4. 10 (2H, q, J=6. 7Hz), 4. 80 (2H, s), 4. 88 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 06 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 80-7. 92 (2H, m), 9. 06 (1H, brs), 9. 37 (1H, brs).

実施例 629

{8-第 3 ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロベンゾ [1,4] オキサジン-4-イル)-酢酸 メチルエステル; 臭化水素酸塩}

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 30-1. 41 (12H, m), 2. 77 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 48 (2H, brs), 3. 64 (3H, s), 4. 20-4. 33 (6H, m), 4. 86 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 04 (1H, s), 7. 26 (1H, s), 7. 98 (1H, s), 8. 52 (1H, q, J=8Hz).

25

実施例 630

8-第 3 ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサ
ジン-2-カルボン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 38 (9H, s), 2. 88 (3H, s), 3. 23-3. 42 (2H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 79 (2H, s), 5.
15 (1H, t, J=3. 9Hz), 5. 45 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 32 (1H, s), 7. 35 (1H, s).

実施例 631

(アセチル-(2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル)-アミノ)-酢酸 第

- 10 3 ブチル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 32 (9H, s), 1. 42 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 74 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz) 3.
68 (1H, d, J=16. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 49 (1H, d, J=16. 8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 53
(2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 73 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 98 (1H, dd, J=8. 0, 2. 0Hz), 8. 15 (1H, d, J
15 =2. 0Hz), 8. 21 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s).

実施例 632

(アセチル-(2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル)-アミノ)-酢酸;塩
酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 73 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 67 (1H, d, J=
16. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 56 (1H, d, J=16. 8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 58 (2H, s), 7. 5
4 (1H, s), 7. 75 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 97 (1H, dd, J=8. 0, 2. 0Hz), 8. 17 (1H, d, J=2. 0Hz), 8.
21 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 34-9. 40 (1H, m), 9. 90-9. 98 (1H, m).

- 25 実施例 633

(2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド

ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル)-メチル-アミノ)-酢酸 第3ブ
チル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 41 (3H, t, J=5. 2Hz), 1. 44 (18H, s), 2. 59 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 49 (1H, brs), 4. 27 (2H, q, J=5. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 64 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 90 (1H, dd, J=8. 4, 2. 4Hz), 7. 94 (1H, d, J=2. 4Hz), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s).

実施例 634

- 10 {2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 0. 95 (6H, t, J=7. 2Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 0Hz), 3. 11 (4H, q, J=7. 2Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 73 (2H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 54 (2H, s), 7. 59 (1H, s), 8. 20 (1H, brs), 8. 55 (1H, s), 9. 17 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 553. 3 (MH⁺)

実施例 635

- 20 {(2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル)-メチル-アミノ)-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 44 (9H, s), 2. 62 (3H, s), 2. 82 (3H, s), 3. 83 (1H, d, J=8. 8Hz), 4. 17 (1H, d, J=8. 8Hz), 4. 27 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 6. 34 (1H, s), 7. 66 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 91 (1H, dd, J=8. 0, 1. 6Hz), 7. 94 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 29-9. 33 (1H, m), 9. 48-9. 92 (1H, m).

実施例 636

{2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-

ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 38 (9H, s), 1. 85-1. 90 (4H, m), 2. 77 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 07-3. 15 (4H, m), 4. 39 (2H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 40 (1H, s), 7. 47 (1H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 36 (1H, brs), 8. 90 (1H, brs), 9. 53 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 550. 4 (MH⁺)

実施例 637

- 10 2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-イソプロポキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 33 (6H, d, J=6. 0Hz), 1. 41 (9H, s), 2. 80 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 94 (6H, s), 4. 68 (1H, m), 4. 76 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 48 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 8. 10 (1H, s), 8. 39 (1H, m).

実施例 638

- 20 2-[2-(4-アセチル-8-第3ブチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 39 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 30 (3H, s), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 91 (2H, t, J=4. 8Hz), 4. 29 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 48 (2H, t, J=4. 8Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 67 (1H, s), 8. 00 (1H, brs), 8. 22 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 22 (1H, s), 9. 84 (1H, s).

実施例 639

12-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモ

イル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-酢酸 エチル
ルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.94 (6H, t, J=6.8Hz), 1.23 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.83
5 (3H, d, J=4.8Hz), 3.05-3.10 (4H, m), 4.17 (2H, q, J=6.8Hz), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.8
0 (2H, s), 4.84 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.54 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.61 (1H, s), 8.21 (1H, d
, J=4.8Hz), 8.56 (1H, s), 9.29 (1H, brs), 9.90 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 581.4 (MH⁺)

実施例 640

10 {3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-酢酸;臭化水素
酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.38 (3H, t, J=7.2Hz), 1.41 (9H, s), 3.79 (2H, brs), 4.12 (2H, q,
15 J=7.2Hz), 4.23 (2H, q, J=7.2Hz), 4.25 (2H, s), 4.80 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.33 (1H, s),
7.84 (1H, s), 7.91 (1H, s), 9.07 (1H, s), 9.37 (1H, s).

実施例 641

20 [2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(エチル-メタンスルフォニル-アミノ)-
フェノキシ]-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.05 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.27
(3H, s), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.69-4.93 (6H, m), 5.52 (2H, s), 7.55 (1H, s), 7.86 (1H,
s), 7.89 (1H, s), 8.21 (1H, d, J=4.4Hz), 8.56 (1H, s), 9.24 (1H, brs), 9.88 (1H, brs).

25 MS:m/e (ESI) 603.3 (MH⁺)

実施例 642

{2-(アセチル-エチル-アミノ)-6-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-アセチル}-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 05 (3H, t, J=6.8Hz), 1.33-1.43 (12H, m), 1.89 (3H, s), 2.82 (3H, d, J=4.8), 2.96-3.12 (1H, m), 4.08-4.19 (1H, m), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.48 (2H, dd, J=15.2Hz, 15.6Hz), 4.86 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.54 (1H, s), 7.81 (1H, s), 7.89 (1H, s), 8.21 (1H, d, J=4.4Hz), 8.56 (1H, s), 9.26 (1H, brs), 9.88 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 567.3 (MH⁺)

10 実施例 643

{2-(アセチル-メチル-アミノ)-6-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-アセチル}-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.36-1.43 (12H, m), 1.83 (3H, s), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 3.15 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.44 (2H, dd, J=15.6Hz, 15.6Hz), 4.85 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.54 (1H, s), 7.87 (1H, s), 7.95 (1H, s), 8.21 (1H, d, J=4.4Hz), 8.55 (1H, s), 9.23 (1H, brs), 9.88 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 553.3 (MH⁺)

実施例 644

- 20 {2-第3ブチル-4-[2-(1-イミノ-6-メチルカルバモイル-5-プロポキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 0.98 (3H, t, J=7.6Hz), 1.23 (3H, t, J=7.2Hz), 1.38 (9H, s), 1.85-1.90 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.06-3.12 (4H, m), 4.17 (2H, q, J=6.4Hz), 4.20 (2H, q, J=7.2), 4.49 (2H, s), 4.83 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.42 (1H, br), 7.49 (1H, br), 7.54 (1H, s), 8.52 (1H, s), 9

. 15 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

実施例 645

{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-イソプロポキシフェノキシ}-酢酸;臭化

5 水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (6H, d, J=6. 0Hz), 1. 39 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 64 (2H, s), 4. 75 (1H, m), 4. 87 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 53 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 22 (1H, m), 8. 59 (1H, s), 9. 28 (1H, m), 9. 89 (1H, s).

10 実施例 646

{2-第3ブチル-6-シクロペンチルオキシ-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカル
ルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢
酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 38 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 63 (2H, m), 1. 69-1. 83 (4H, m), 1. 95 (2H, m), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 59 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 4. 93 (1H, m), 5. 55 (2H, s), 7. 48 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 22 (1H, m), 8. 59 (1H, s), 9. 88 (1H, s).

実施例 647

20 7-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾオキサゾール-2-イル-シアナミド;臭化水
素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 39 (3H, t, J=7Hz), 1. 48 (3H, t, J=7Hz), 1. 51 (9H, s), 4. 20 (2H, q, J=7Hz), 4. 25 (2H, J=7Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 22 (1H, s), 7. 91 (2H, d, J=2Hz), 8. 11 (2H, J=2Hz).

MS: m/e (ESI) 512. 0 (MH⁺)

実施例 648

{2-第 3 プチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル; トリフルオロ酢酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 23 (3H, t, J=6.8 Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 82-1. 91 (4H, m), 2. 77 (3H, d, J=4. 4 Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 04-3. 14 (4H, m), 4. 21 (2H, q, J=6. 8 Hz), 4. 49 (2H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 48 (1H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 33-8. 41 (1H, m), 8. 93 (1H, brs), 9. 54 (1H, brs).

10 MS:m/e (ESI) 578. 3 (MH⁺)

実施例 649

(アセチル-{3-第 3 プチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-アミノ)-酢酸 メチルエステル; トリフルオロ酢酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 06 (3H, s), 3. 67 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 96 (3H, s), 4. 40 (2H, s), 4. 52 (2H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 79 (1H, s), 7. 94 (1H, s), 9. 06 (1H, s), 9. 34 (1H, s), 10. 90 (1H, s).

実施例 650

20 {2-第 3 プチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 33 (3H, t, J=7. 0 Hz), 1. 38 (9H, s), 2. 80 (3H, d, J=7. 2 Hz), 4. 26 (2H, s), 4. 26 (2H, q, J=7. 0 Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 38 (2H, s), 7. 49 (1H, d, J=6. 0 Hz), 7. 52 (1H, s), 7. 73 (1H, dd, J=6. 0, 2. 0 Hz), 7. 77 (1H, d, J=2. 0 Hz), 8. 15-8. 24 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 18-9. 23 (1H, m),

9.78-9.82 (1H, m).

実施例 651

{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル]-アセチル}-フェニルアミノ-酢酸 エチルエステル;臭
化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.19 (3H, t, J=7.2Hz), 1.40 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 4.12
(2H, q, J=7.2Hz), 4.18 (2H, d, J=6.4Hz), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.82 (2H, s), 5.36 (2H,
s), 5.92 (1H, t, J=6.8Hz), 6.57 (1H, d, J=8.8Hz), 7.51 (1H, s) 7.72 (1H, dd, J=8.8, 2.0H
z), 8.20 (1H, q, J=4.8Hz), 8.54 (1H, s).

実施例 652

2-[2-(8-第3ブチル-3-オキシ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イ
ル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.39 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=6.8Hz), 2.84 (3H, d, J=4.4Hz), 4.30 (2H, q, J=6.8Hz), 4.72
(2H, s), 4.86 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.44 (1H, d, J=2.0Hz), 7.56 (2H, s), 8.22 (1H, q, J=4
.4Hz), 8.58 (1H, s), 9.20 (1H, s), 9.86 (1H, s), 10.95 (1H, s).

実施例 653

2-[2-(8-第3ブチル-4-メチル-3-オキシ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジ
ン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (9H, s), 1.44 (3H, t, J=6.8Hz), 2.85 (3H, d, J=4.8Hz), 3.37 (3H, s), 4.30 (2H, q, J=
6.8Hz), 4.78 (2H, s), 4.88 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.56 (1H, s), 7.64 (1H, d, J=1.6Hz), 7.
66 (1H, d, J=1.6Hz), 8.23 (1H, q, J=4.8Hz), 8.58 (1H, s), 9.24 (1H, s), 9.88 (1H, s).

実施例 654

2-[2-(8-第 3 ブチル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 36 (9H, s), 2. 79 (3H, d, $J=4.8\text{Hz}$), 2. 92 (3H, s), 2. 93 (6H, s), 4. 35 (2H, t, $J=4.4$), 4. 7
5 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 16 (1H, s), 7. 18 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7. 29 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 8. 08
(1H, s), 8. 39 (1H, q, $J=4.8\text{Hz}$), 8. 99 (1H, s), 9. 53 (1H, s).

実施例 655

10 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フエノキシ}-酪
酸;トリフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1. 85-1. 94 (4H, m), 1. 97-2. 06 (2H, m), 2. 36-2. 44 (
2H, m), 2. 82 (3H, d, $J=4.8\text{Hz}$), 3. 07-3. 16 (4H, m), 3. 85 (2H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 27 (2H, q, $J=$
7. 2Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 41-5. 50 (2H, m), 7. 36 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 16-
8. 24 (1H, m), 8. 55 (1H, m).

MS: m/e (ESI) 579. 4 (MH $^+$)

実施例 656

20 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フエノキシ}-酪酸;ト
リフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1. 29 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 35-1. 42 (12H, m), 1. 82-1. 92 (4H, m), 1. 94-2. 08 (2H, m), 2. 41
(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 3. 06-3. 16 (4H, m), 3. 60-3. 80 (2H, m), 4. 11 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 20 (2
H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 78 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 35 (1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 7. 45 (1H

, d, J=2.4Hz).

MS:m/e (ESI) 584.4 (MH⁺)

実施例 657

5 5-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.60-1.70 (2H, m), 1.75-1.84 (2H, m), 1.86-1.94 (4H, m), 2.29 (2H, t, J=7.2Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.08-3.17 (4H, m), 3.78-3.92 (2H, m), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.83 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.46 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.03-8.27 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.15 (1H, brs), 9.84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 593.4 (MH⁺)

実施例 658

15 5-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.28 (3H, t, J=6.8Hz), 1.33-1.46 (12H, m), 1.60-1.71 (2H, m), 1.75-1.84 (2H, m), 1.85-1.96 (4H, m), 2.29 (2H, t, J=7.2Hz), 3.07-3.18 (4H, m), 3.76-3.93 (2H, m), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.78 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.35 (1H, s), 7.45 (1H, s), 9.06 (1H, brs), 9.28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 598.4 (MH⁺)

実施例 659

25 {2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 23 (3H, t, J=7.0 Hz), 1. 26-1. 44 (12H, m), 1. 87 (4H, brs), 2. 77 (3H, s), 3. 11 (4H, brs),
4. 14-4. 30 (4H, m), 4. 49 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 49 (1H, s),
8. 53 (1H, brd), 9. 46 (1H, brs), 9. 97 (1H, brs).

5 実施例 660

[2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-フェノ
キシ]-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 27-1. 46 (12H, m), 2. 02-2. 16 (2H, m), 2. 42 (2H, d, J=8.1 Hz), 2. 82 (3H, d, J=4.5 Hz), 3
. 63 (2H, t, J=7.0 Hz), 4. 27 (2H, q, J=6.8 Hz), 4. 45 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7.
54 (1H, s), 7. 84 (2H, s), 8. 17-8. 23 (1H, m), 8. 55 (1H, s).

実施例 661

15 [2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-
酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 26 (3H, t, J=7.1 Hz), 1. 33-1. 45 (12H, m), 2. 04-2. 17 (2H, m), 2. 42 (2H, t, J=8.0 Hz), 3
. 63 (2H, brt, J=6.2 Hz), 4. 11 (2H, q, J=7.1 Hz), 4. 21 (2H, q, J=7.1 Hz), 4. 43 (2H, s), 4. 8
0 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 82 (1H, s), 7. 83 (1H, s).

実施例 662

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキ
シ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 27 (18H, s), 1. 33 (3H, t, J=7Hz), 4. 18 (2H, q, J=7Hz), 4. 71 (2H, s), 5. 39 (2H, s), 7. 06
(1H, s), 7. 65 (2H, s), 8. 53 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 448. 0 (MH⁺)

実施例 663

7-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル-シアナミド;塩

5 酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (3H, t, J=7Hz), 1. 45 (3H, t, J=7Hz), 1. 54 (9H, s), 4. 18 (2H, q, J=7Hz), 4. 26 (2H, q, J=7Hz), 4. 92 (2H, s), 5. 59 (2H, s), 7. 23 (2H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 22 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 511. 0 (MH⁺)

10 実施例 664

2-[2-(8-第 3 ブチル-4-メチル-2-オキシ-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジ
ン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 41 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 77 (3H, s), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 61 (2H, s), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 67 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 86 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 22 (1H, m), 8. 59 (1H, s).

実施例 665

20 3-{2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒ
ドロ-イン
ドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイルアミノ}-プロパン酸;トリ
フルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 39 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 50 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 42 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 28 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 32 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 85 (1H, t, J=7. 6Hz), 8. 00 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=4. 8Hz), 8. 52 (1H, t, J=5. 2), 8. 57 (1H, s), 9. 28 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 523. 3 (MH⁺)

実施例 666

2-(2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイルアミノ}-プロパン酸;トリフル

5 ルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 17-1. 44 (15H, m), 2. 83 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 39-4. 42 (1H, m), 4. 88 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 40 (1H, d, J=7. 6Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 88 (1H, d, J=9. 6Hz), 8. 01 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s), 8. 81 (1H, d, J=7. 6Hz), 9. 28 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs).

10

MS:m/e (ESI) 523. 3 (MH⁺)

実施例 667

2-(2-シクロペンチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 52-1. 69 (4H, m), 1. 70-1. 80 (2H, m), 1. 93-2. 05 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 0Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 05 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 83 (1H, s), 7. 85 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=4. 0Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 21 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

20

MS:m/e (ESI) 494. 4 (MH⁺)

実施例 668

2-(第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ)-酢酸;トリフル

25

オロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7.2Hz), 2. 70 (6H, s), 4. 12 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 66 (2H, s), 4. 79 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 9. 06 (1H, brs), 9. 30 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 530. 3 (MH⁺)

5 実施例 669

2-[第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジエチルアミノ-フェノキシ]-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 0. 95 (6H, t, J=7.2Hz) 1. 29 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6.8Hz), 3. 10 (4H, q, J=7.2Hz), 4. 13 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 72 (2H, s), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 59 (1H, s), 9. 05 (1H, brs), 9. 29 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 558. 4 (MH⁺)

実施例 670

15 2-[2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 39 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7Hz), 1. 95-2. 03 (2H, m), 2. 25-2. 31 (2H, m), 2. 83 (3H, d, J=5Hz), 4. 03-4. 08 (2H, m), 4. 28 (2H, q, J=7Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 43 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=5Hz), 8. 53 (1H, s), 9. 17 (brs, 1H), 9. 46 (s, 1H).

実施例 671

25 2-[第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ]-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 23 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37-1. 41 (12H, m), 2. 67 (6H, s), 4. 10 (4H, q, J=6. 8Hz), 4. 20 (4H, q, J=7. 2Hz), 4. 73 (2H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 45 (1H, s), 7. 31 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 9. 07 (1H, brs), 9. 39 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 558. 4 (MH⁺)

実施例 672

〔2-第 3 ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジエチルアミノ-フェノキシ]-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 94 (6H, t, J=7. 2Hz), 1. 23 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (6H, t, J=7. 2Hz), 3. 07 (4H, q, J=7. 2), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 20 (4H, q, J=7. 2Hz), 4. 80 (4H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 60 (1H, s), 9. 07 (1H, brs), 9. 39 (1H, brs).

15 MS:m/e (ESI) 586. 3 (MH⁺)

実施例 673

〔2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-6-エチルカルバモイル-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;塩酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 13 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 85-1. 93 (4H, m), 3. 06-3. 15 (4H, m), 4. 25 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 40 (2H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 41 (1H, s), 7. 48 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 8. 23 (1H, tJ=4. 8Hz), 8. 51 (1H, s), 9. 21 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

25 MS:m/e (ESI) 565. 4 (MH⁺)

実施例 674

[2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-プロピルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

- 5 0.93(3H, t, J=7.2Hz), 1.38(9H, s), 1.41(3H, t, J=7.2Hz), 1.49-1.57(2H, m), 1.85-1.92(4H, m), 3.06-3.15(4H, m), 3.21-3.29(2H, m), 4.25(2H, q, J=7.2Hz), 4.40(2H, s), 4.83(2H, s), 5.51(2H, s), 7.41(1H, s), 7.48(1H, s), 7.52(1H, s), 8.22(1H, t, J=4.8Hz), 8.50(1H, s), 9.22(1H, brs), 9.86(1H, brs).

MS:m/e (ESI) 579.4 (MH⁺)

10 実施例 675

[2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-6-エチルカルバモイル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

- 15 1.13(3H, t, J=7.2Hz), 1.23(3H, t, J=7.2Hz), 1.38(9H, s), 1.41(3H, t, J=7.2Hz), 1.84-1.91(4H, m), 3.06-3.14(4H, m), 4.17-4.28(4H, m), 4.49(2H, s), 4.83(2H, s), 5.52(2H, s), 7.43(1H, s), 7.49(1H, s), 7.52(1H, s), 8.23(1H, t, J=4.8Hz), 8.52(1H, s), 9.24(1H, brs), 9.86(1H, brs).

MS:m/e (ESI) 593.4 (MH⁺)

20 実施例 676

[2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-プロピルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ]-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

- 25 0.92(3H, t, J=7.2Hz), 1.23(3H, t, J=7.2Hz), 1.38(9H, s), 1.41(3H, t, J=7.2Hz), 1.50-1.58(2H, m), 1.84-1.92(4H, m), 3.07-3.14(4H, m), 3.21-3.28(2H, m), 4.17-4.28(4H, m), 4.49(2H, s), 4.83(2H, s), 5.52(2H, s), 7.43(1H, s), 7.49(1H, s), 7.52(1H, s), 8.23(1H, t, J=4.8Hz), 8.52(1H, s), 9.24(1H, brs), 9.86(1H, brs).

, m), 4. 49 (2H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 43 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 8. 22 (1H, t, J=4. 8Hz), 8. 50 (1H, s), 9. 19 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 607. 4 (MH⁺)

実施例 677

- 5 1-(3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル)-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 27 (6H, t, J=7Hz), 1. 39 (9H, s), 2. 29-2. 35 (1H, m), 2. 54-2. 75 (2H, m), 2. 95 (1H, dd, J=12, 9Hz), 3. 20 (3H, d, J=5Hz), 4. 15-4. 28 (3H, m), 4. 35 (2H, q, J=7Hz), 4. 54 (1H, d, J=19Hz), 5. 30 (1H, d, J=11Hz), 5. 40 (1H, d, J=19Hz), 5. 33 (1H, d, J=11Hz), 7. 17 (1H, s), 7. 20 (1H, s), 7. 95 (1H, d, J=2Hz) 8. 17 (1H, q, J=5Hz), 8. 38 (1H, s), 8. 78 (1H, d, J=2Hz), 9. 45 (1H, brs), 10. 02 (1H, br. 2), 10. 08 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 579. 0 (MH⁺)

- 15 実施例 678

1-(3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル)-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 28 (3H, t, J=7Hz), 1. 41 (3H, t, J=7Hz), 1. 42 (9H, s), 1. 54 (3H, t, J=7Hz), 2. 24-2. 31 (1H, m), 2. 58 (1H, ddd, J=14, 8, 3Hz), 2. 66 (td, J=14, 5Hz), 2. 93 (1H, ddd, J=14, 11, 8Hz), 4. 16-4. 28 (7H, m), 4. 70 (1H, d, J=19Hz), 5. 05 (1H, d, J=19Hz), 5. 17 (1H, d, J=19Hz), 5. 32 (1H, d, J=19Hz), 6. 88 (1H, s), 7. 93 (1H, d, J=2Hz), 8. 35 (1H, d, J=2Hz), 8. 83 (1H, s).

- 25 MS:m/e (ESI) 584. 0 (MH⁺)

実施例 679

1-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 18 (3H, t, J=7Hz), 1. 42 (9H, s), 1. 60 (3H, t, J=7Hz), 2. 32-2. 36 (1H, m), 2. 54-2. 67 (2H, m), 2. 77-2. 84 (1H, m), 3. 16 (3H, d, J=5Hz), 3. 80 (3H, s), 4. 11-4. 22 (2H, m), 4. 36 (2H, q, J=7Hz), 4. 74 (1H, d, J=19Hz), 4. 75 (1H, m), 4. 93 (1H, d, J=19Hz), 5. 69 (1H, d, J=18Hz), 6. 56 (1H, d, J=18Hz), 7. 21 (1H, s), 7. 25 (1H, s), 8. 05 (1H, d, J=2Hz), 8. 13 (1H, d, J=2Hz), 8. 19 (1H, q, J=5Hz), 9. 48 (1H, s).
- 10 MS: m/e (ESI) 593. 0 (MH⁺)

実施例 680

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

- 15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :
1. 18 (3H, t, J=7Hz), 1. 42 (3H, t, J=7Hz), 1. 43 (9H, s), 1. 54 (3H, t, J=7Hz), 2. 31-2. 36 (1H, m), 2. 54-2. 65 (2H, m), 2. 76-2. 84 (1H, m), 3. 81 (3H, s), 4. 15-4. 23 (6H, m), 4. 65 (1H, d, J=18Hz), 4. 74 (1H, dt, J=2, 6Hz), 4. 86 (1H, d, J=18Hz), 5. 61 (1H, d, J=19Hz), 6. 87 (1H, s), 6. 98 (1H, brs), 8. 03 (1H, d, J=2Hz), 8. 11 (1H, d, J=2Hz).
- 20 MS: m/e (ESI) 593. 0 (MH⁺)

実施例 681

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-7-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :
1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 44 (18H, s), 2. 86 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 8

3 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 77 (2H, s), 7. 81 (1H, s), 8. 34 (1H, s), 8. 72 (1H, m).

実施例 682

2-[2-(5-第3 ブチル-2-オキシノ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-7-イル)-2-オキシノ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン

5 酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 43 (12H, m), 2. 45 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 18 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 41 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 56 (1H, s), 7. 61 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 23 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 22 (1H, s), 9. 86 (1H, s), 10. 33 (1H, s).

10

実施例 683

2-[2-[3-第3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシノ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸 アミド;トリフルオロ酢酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 93-2. 04 (2H, m), 2. 28 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 05 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 6. 83 (1H, brs), 7. 33 (1H, brs), 7. 44 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 70 (1H, brs), 7. 78 (1H, brs), 8. 63 (1H, s), 9. 18 (1H, brs), 9. 46 (1H, s), 9. 82 (1H, brs).

20

MS:m/e (ESI) 511. 3 (MH⁺)

実施例 684

2-[2-[3-第3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシノ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸 ジメチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

25

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29-1. 46 (12H, m), 1. 93-2. 06 (2H, m), 2. 23-2. 33 (2H, m), 2. 78 (3H, s), 2. 99 (3H, s), 4

. 01-4. 12 (2H, m), 4. 17-4. 28 (2H, m), 4. 83 (3H, s), 5. 45 (3H, s), 6. 83 (1H, brs), 7. 33 (1H, brs), 7. 44 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 8. 03 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 46 (1H, brs), 9. 67 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 539. 4 (MH⁺)

5 実施例 685

2-[2-[3-第 3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 39 (9H, s), 1. 93-2. 04 (2H, m), 2. 23-2. 33 (2H, m), 2. 77 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 93 (6H, s), 4. 01-4. 09 (2H, m), 4. 73 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 7. 14 (1H, s), 7. 43 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 51 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 06 (1H, s), 8. 34-8. 39 (1H, m), 8. 86 (1H, brs), 9. 44 (1H, brs), 9. 52 (1H, brs).

実施例 686

- 15 4-[3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ]-ブチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 28 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 34-1. 46 (12H, m), 1. 94-2. 04 (2H, m), 2. 24-2. 32 (2H, m), 4. 00-4. 08 (2H, m), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 6. 82 (1H, brs), 7. 28-7. 36 (2H, m), 7. 42 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 9. 00-9. 08 (1H, m), 9. 32 (1H, brs), 9. 46 (1H, s).

実施例 687

- 25 4-[3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ]-ブチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 92-2. 05 (2H, m), 2. 23-2. 34 (2H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 01-4. 09 (2H, m), 4. 81 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 6. 83 (1H, brs), 7. 31-7. 38 (2H, m), 7. 42 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 9. 04-9. 11 (1H, m), 9. 30-9. 38 (1H, m), 9. 46 (1H, s).

5 実施例 688

4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 30 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 94-2. 05 (2H, m), 2. 24-2. 34 (2H, m), 2. 95 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 01-4. 11 (2H, m), 4. 85 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 6. 82 (1H, brs), 7. 34 (1H, brs), 7. 44 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 73 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 18 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 46 (1H, brs), 9. 52-9. 60 (1H, m), 9. 82-9. 90 (1H, m).

実施例 689

15 4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 03-1. 13 (4H, m), 1. 41 (9H, s), 1. 94-2. 05 (2H, m), 2. 24-2. 38 (3H, m), 4. 01-4. 09 (2H, m), 4. 82 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 6. 83 (1H, brs), 7. 35 (1H, brs), 7. 44 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 10 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 47 (1H, brs), 9. 48-9. 56 (1H, m), 9. 62-9. 70 (1H, m).

実施例 690

25 2-[2-{3-第 3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-イミノ-6-プロポキシ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.99 (3H, t, J=7.2Hz), 1.41 (9H, s), 1.75-1.87 (2H, m), 1.93-2.02 (2H, m), 2.24-2.32 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 4.02-4.08 (2H, m), 4.13-4.20 (2H, m), 4.83 (2H, s), 5.46 (2H, s), 6.83 (1H, brs), 7.34 (1H, brs), 7.42 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.15-8.21 (1H, m), 8.52 (1H, s), 9.18 (1H, brs), 9.46 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

5

実施例 691

[6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-酢酸; 塩酸塩

10

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.26 (6H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 1.68-1.74 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.38-3.46 (2H, m), 4.21 (2H, s), 4.27 (2H, q, J=7.2Hz), 4.83 (2H, s), 5.35 (2H, s), 6.57 (1H, d, J=8.0Hz), 7.52 (1H, s), 7.63 (1H, d, J=8.0Hz), 7.75 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s), 9.18 (1H, brs), 9.78 (1H, brs).

15

MS: m/e (ESI) 493.3 (MH⁺)

実施例 692

[6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-酢酸; 塩酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.26 (6H, s), 1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.39 (3H, t, J=7.2Hz), 1.68-1.74 (2H, m), 3.38-3.45 (2H, m), 4.07-4.22 (4H, m), 4.20 (2H, s), 4.77 (2H, s), 5.35 (2H, s), 6.57 (1H, d, J=8.4Hz), 7.31 (1H, s), 7.61 (1H, d, J=8.4Hz), 7.75 (1H, s), 8.99 (1H, brs), 9.33 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 498.3 (MH⁺)

25

実施例 693

[2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ

-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ビペリジン-1-イルフェノキシ}-酢酸;
トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

- 5 1. 39(9H, s), 1. 43(3H, t, J=7Hz), 1. 49-1. 57(2H, m), 1. 63-1. 70(4H, m), 2. 85(3H, d, J=5Hz), 2. 88-2. 98(4H, m), 4. 30(2H, q, J=7Hz), 4. 85(2H, s), 4. 87(2H, s), 5. 52(2H, s), 7. 56(1H, s), 7. 58(1H, s), 7. 63(1H, s), 8. 23(1H, q, J=5Hz), 8. 58(1H, s), 9. 22(1H, brs), 9. 87(1H, brs).

実施例 694

- 10 {2-第3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

- 15 1. 39(9H, s), 1. 43(3H, t, J=7Hz), 2. 85(3H, d, J=5Hz), 2. 95-3. 03(4H, m), 3. 61-3. 68(4H, m), 4. 29(2H, q, J=7Hz), 4. 82(2H, s), 4. 87(2H, s), 5. 52(2H, s), 7. 56(1H, s), 7. 58(1H, s), 7. 63(1H, s), 8. 23(1H, q, J=5Hz), 8. 57(1H, s), 9. 22(1H, brs), 9. 87(1H, brs).

実施例 695

- 20 {2-第3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ビペリジン-1-イルフェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ:

- 25 1. 31(3H, t, J=7Hz), 1. 38(9H, s), 1. 42(3H, t, J=7Hz), 1. 50-1. 57(2H, m), 1. 63-1. 71(4H, m), 2. 88-2. 97(4H, m), 4. 13(2H, q, J=7Hz), 4. 23(2H, q, J=7Hz), 4. 80(2H, s), 4. 86(2H, s), 5. 50(2H, s), 7. 35(1H, s), 7. 56(1H, s), 7. 62(1H, s), 9. 07(1H, brs), 9. 32(1H, brs).

実施例 696

{2-第3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ

インドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェノキシ)-酢酸;トリフルオ
ロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 31 (3H, t, J=7Hz), 1. 39 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7Hz), 2. 95-3. 03 (4H, m), 3. 71-3. 78 (4
H, m), 4. 13 (2H, q, J=7Hz), 4. 23 (2H, q, J=7Hz), 4. 80 (2H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 52 (2H, s),
7. 35 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 65 (1H, s), 9. 07 (1H, brs), 9. 33 (1H, brs).

実施例 697

- 10 4-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ)-酢酸 エチル
エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 16 (3H, t, J=6. 5Hz), 1. 32-1. 46 (12H, m), 1. 95-2. 08 (2H, m), 2. 57 (2H, t, J=7. 0Hz), 2
. 83 (3H, d, J=5. 0Hz), 4. 00-4. 10 (4H, m), 4. 26 (H, q, J=6. 5Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 45 (2H, s
) , 7. 40 (1H, brs), 7. 48-7. 55 (2H, m), 8. 19 (1H, 5. 0Hz), 8. 54 (1H, s).

- 15 実施例 698

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-
オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル
ボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 94-2. 08 (2H, m), 2. 28 (2H, t, J=7. 5Hz), 2. 82 (3H
, s), 3. 89 (3H, s), 4. 06 (2H, t, J=5. 5Hz), 4. 26 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 50 (2H,
s), 6. 80 (1H, brs), 7. 37 (1H, brs), 7. 48-7. 55 (3H, m), 8. 17-8. 25 (1H, m), 8. 55 (1H, s),
9. 25 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

- 25 実施例 699

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-

オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル
ボン酸 アミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 35 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 94-2. 07 (2H, m), 2. 24-2. 31 (2H, m), 3. 90 (3H, s)
 , 4. 07 (2H, t, J=6. 5Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 6. 80 (1H, brs)
), 7. 37 (1H, brs), 7. 48-7. 54 (3H, m), 8. 63 (1H, s).

実施例 700

2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-
 10 オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 34 (9H, s), 1. 93-2. 08 (2H, m), 2. 24-2. 35 (2H, m), 2. 76 (3H, brs), 2. 82 (6H, s), 3. 89 (3H, s),
 4. 03-4. 12 (2H, m), 4. 74 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 14 (1H, s), 7. 36 (1H, brs),
 7. 48-7. 56 (2H, m), 8. 07 (1H, s), 8. 31-8. 42 (1H, m), 9. 01 (1H, brs), 9. 57 (1H, brs).

実施例 701

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
 20 ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化
水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 26 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 94-2. 07 (2H, m), 2. 27 (2H, t,
 J=6. 5Hz), 3. 88 (3H, s), 4. 02-4. 15 (4H, m), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 48 (2H, s),
 7. 32 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 7. 51 (1H, s).

実施例 702

4-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
 25 ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化

水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 94-2. 08 (2H, m), 2. 26 (2H, t, J=6. 5Hz), 3. 86 (3H, s), 3. 89 (3H, s), 3. 92 (3H, s), 4. 06 (2H, t, J=5. 5Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 34-7. 39 (2H, m), 7. 50 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 9. 10 (1H, brs), 9. 38 (1H, brs).

実施例 703

4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェノキシ}-ブチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 30 (3H, t, J=7. 5Hz), 1. 35 (9H, s), 1. 94-2. 08 (2H, m), 2. 27 (2H, t, J=7. 0Hz), 2. 94 (2H, q, J=7. 5Hz), 3. 89 (3H, s), 4. 06 (2H, t, J=5. 5Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 37 (1H, brs), 7. 50 (2H, brs), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 18 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 56 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

実施例 704

- 15 4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェノキシ}-ブチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 05-1. 12 (4H, m), 1. 35 (9H, s), 1. 94-2. 07 (2H, m), 2. 23-2. 36 (3H, m), 3. 89 (3H, s), 4. 06 (2H, t, J=5. 5Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 36 (1H, brs), 7. 51 (2H, brs), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 48-9. 55 (1H, m), 9. 64-9. 72 (1H, m).

実施例 705

- 25 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロボキシ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 エチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 11 (3H, t, J=6.0Hz), 1. 24-1. 45 (12H, m), 1. 96-2. 07 (2H, m), 2. 22-2. 33 (2H, m), 3. 23-3. 39 (2H, m), 3. 89 (3H, s), 4. 02-4. 12 (2H, m), 4. 19-4. 30 (2H, m), 4. 83 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 35 (1H, brs), 7. 51 (3H, brs), 8. 23 (1H, brs), 8. 52 (1H, s), 9. 21 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

5

実施例 706

4-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-1-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-カルボ
ン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

10

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 54 (9H, s), 1. 62 (3H, t, J=7Hz), 3. 21 (3H, d, J=5Hz) 4. 06 (3H, s), 4. 37 (2H, q, J=7Hz), 4. 38 (3H, s), 5. 04 (2H, s), 6. 32 (2H, s), 7. 21 (1H, s), 7. 25 (1H, s), 7. 84 (1H, d, J=2Hz), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 93 (1H, d, J=2Hz), 9. 56 (1H, s), 10. 44 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 520. 0 (MH⁺)

15

実施例 707

4-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ}-酪酸 エチルエ
ステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20

1. 21 (3H, t, J=7Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 2. 01-2. 09 (2H, m), 2. 48-2. 57 (2H, m), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 3. 88 (3H, s), 4. 07-4. 13 (2H, m), 4. 09 (2H, q, J=7Hz), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 25 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

実施例 708

25

4-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ}-酪酸 エチルエ
ステ

ル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 20 (3H, t, J=7Hz), 1. 32 (3H, t, J=7Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7Hz), 2. 00-2. 09 (2H, m), 2. 50-2. 56 (2H, m), 3. 88 (3H, s), 4. 09 (2H, q, J=7Hz), 4. 13 (2H, q, J=7Hz), 4. 23 (2H, q, J=7Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 71 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 56 (1H, s).

実施例 709

〔2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 2. 78 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 92 (6H, s), 4. 04-4. 10 (2H, m), 4. 72 (2H, s), 5. 32 (2H, s), 6. 57 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 14 (1H, s), 7. 73 (1H, dd, J=8. 4, 2. 0Hz), 7. 77 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 05 (1H, s), 8. 36 (1H, t, J=4. 8Hz), 8. 90-8. 94 (1H, m), 9. 45-9. 50 (1H, m).

実施例 710

- 15 5-第3ブチル-7-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾ[d]ピロロ[2,1-b]オキサゾール-3a-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 27 (3H, J=7Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 61 (3H, t, J=7Hz), 1. 91 (1H, m), 2. 05 (1H, m), 2. 27 (1H, ddd, J=13, 7, 6Hz), 2. 72 (1H, ddd, J=13, 7, 6Hz), 3. 12 (3H, d, J=5Hz), 3. 44 (1H, ddd, J=15, 7, 6Hz), 3. 58 (1H, ddd, J=15, 7, 6Hz), 4. 23 (1H, dq, J=10, 7Hz), 4. 25 (1H, dq, J=10, 7Hz), 4. 45 (2H, brs), 4. 71 (1H, d, J=18Hz), 4. 99 (1H, d, J=18Hz), 5. 70 (1H, d, J=19Hz), 6. 46 (1H, d, J=19Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 72 (1H, s), 8. 30 (1H, q, J=5Hz), 9. 50 (1H, s), 10. 19 (1H, brs), 10. 36 (1H, brs).

- 25 MS:m/e (ESI) 563. 0 (MH⁺)

実施例 711

3-{4-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-1-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル}-プロパン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 20 (3H, t, J=7Hz), 1. 28 (3H, t, J=7Hz), 1. 57 (9H, s), 3. 03 (2H, t, J=7Hz), 3. 18 (2H, t, J=7Hz), 3. 19 (3H, d, J=5Hz), 3. 92 (3H, s), 4. 17 (2H, q, J=7Hz), 4. 37 (2H, q, J=7Hz), 5. 04 (2H, s), 6. 24 (2H, s), 7. 20 (1H, s), 7. 76 (1H, s), 8. 04 (1H, q, J=5Hz), 8. 67 (1H, s), 9. 56 (1H, s), 10. 21 (1H, brs), 10. 32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 562. 0 (MH⁺)

10 実施例 712

{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 38 (9H, s), 2. 70 (6H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 66 (2H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 9. 09 (1H, brs), 9. 31 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 502. 2 (MH⁺)

実施例 713

{2-(1-アミノ-1-メチル-エチル)-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 224 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 401 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 746 (6H, s), 2. 813 (3H, d, J=4. 4Hz),
4. 188 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 265 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 852 (2H, s), 5. 097 (2H, s), 5. 633 (2H, s), 7. 269 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 514 (1H, s), 7. 943 (1H, s), 8. 048 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 18
25 -8. 24 (1H, m), 8. 560 (1H, s), 8. 587 (2H, s), 9. 658 (1H, s), 9. 999 (1H, s).

実施例 714

{2-(1-アミノ-1-メチル-エチル)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 223 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1. 283 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 389 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 759 (6H, s), 4. 103 (2H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 4. 15-4. 24 (4H, m), 4. 816 (2H, s), 5. 097 (2H, s), 5. 676 (2H, s), 7. 263 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7. 329 (1H, s), 7. 954 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 8. 034 (1H, dd, $J=2.0, 8.8\text{Hz}$), 8. 668 (2H, s), 9. 141 (1H, s), 9. 765 (1H, s).

10 実施例 715

{2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1. 31 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1. 38 (9H, s), 2. 77 (3H, d, $J=4.4\text{Hz}$), 2. 92 (6H, s), 3. 70-3. 82 (2H, m), 3. 87 (2H, s), 4. 76 (2H, s), 5. 36 (1H, dd, $J=5.6, 2.0\text{Hz}$), 5. 46 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 56 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7. 92 (1H, dd, $J=8.0, 2.4\text{Hz}$), 8. 01 (1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 8. 07 (1H, s), 8. 38 (1H, q, $J=4.4\text{Hz}$), 11. 69 (1H, s).

実施例 716

20 2-{2-[3-第3ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1. 36 (9H, s), 1. 42 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1. 93-2. 02 (2H, m), 2. 21-2. 28 (2H, m), 3. 87 (3H, s), 4. 03-4. 10 (2H, m), 4. 28 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 4. 85 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 6. 78 (1H, brs), 7. 33 (1H, brs), 7. 51 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 70 (1H, brs), 7. 78 (1H, brs), 8. 62 (

1H, s).

実施例 717

4-[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ]-ブチルアミド;臭化

5 水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1. 28(3H, t, J=7Hz), 1. 37(9H, s), 1. 39(3H, t, J=7Hz), 1. 93-2. 02(2H, m), 2. 22-2. 28(2H, m), 3. 87(3H, s), 4. 03-4. 09(2H, m), 4. 11(2H, q, J=7Hz), 4. 21(2H, q, J=7Hz), 4. 80(2H, s), 5. 50(2H, s), 6. 78(1H, brs), 7. 32(1H, brs), 7. 34(1H, s), 7. 50(1H, s), 7. 54(1H, s).

10

実施例 718

2-[2-[3-第3ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メトキシフェニル]-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1. 38(9H, s), 1. 42(3H, t, J=7Hz), 1. 93-2. 02(2H, m), 2. 21-2. 28(2H, m), 2. 82(3H, d, J=5Hz), 3. 87(3H, s), 4. 03-4. 10(2H, m), 4. 28(2H, q, J=7Hz), 4. 85(2H, s), 5. 51(2H, s), 6. 78(1H, brs), 7. 32(1H, brs), 7. 51(1H, s), 7. 55(1H, s), 7. 56(1H, s), 8. 21(1H, q, J=5Hz), 8. 56(1H, s).

20

実施例 719

[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

25

1. 29(3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38(9H, s), 1. 40(3H, t, J=6. 8Hz), 1. 78-1. 84(1H, m), 1. 97-2. 05(1H, m), 2. 91(1H, brd, J=10. 4Hz), 3. 04-3. 09(1H, m), 3. 21-3. 40(2H, m), 4. 11(2H, q

, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.32 (2H, ABq, J=16.0Hz), 4.34 (1H, br), 4.78 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.35 (1H, s), 7.44 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 572.4 (MH⁺)

実施例 720

- 5 [2-第3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.08-1.10 (4H, m), 1.38 (9H, s), 1.77-1.84 (1H, m), 1.99-2.06 (1H, m), 2.08-2.16 (1H, m), 2.90-2.96 (1H, m), 3.03-3.09 (1H, m), 3.29-3.40 (2H, m), 4.35 (1H, br), 4.39 (2H, ABq, J=15.6Hz), 4.82 (2H, s), 5.57 (2H, s), 7.37 (1H, d, J=2.0Hz), 7.45 (1H, d, J=2.4Hz), 7.72 (1H, d, J=8.0Hz), 8.10 (1H, d, J=8.0Hz), 9.47 (1H, brs), 9.66 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 507.4 (MH⁺)

実施例 721

- 15 [1-(3-第3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル)-ピロリジン-3-イルオキシ]-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.94-2.01 (1H, m), 2.07-2.14 (1H, m), 2.94 (1H, brd, J=8.0Hz), 3.01-3.17 (2H, m), 3.37-3.42 (1H, m), 3.97 (2H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.25 (1H, br), 4.78 (2H, s), 5.47 (2H, d, J=8.0Hz), 7.32 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.70 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 572.3 (MH⁺)

実施例 722

- 25 [1-(3-第3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル)-ピロリジン-3-イル]

ルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 08-1. 10 (4H, m), 1. 39 (9H, s), 1. 95-2. 01 (1H, m), 2. 10-2. 15 (1H, m), 2. 28-2. 33 (1H, m), 2. 94 (1H, brd, J=7. 6Hz), 3. 01-3. 06 (1H, m), 3. 09-3. 14 (1H, m), 3. 41 (1H, br), 4. 00 (2H, s), 4. 27 (1H, br), 4. 81 (2H, s), 4. 53 (2H, d, J=6. 0Hz), 7. 58 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 7. 71 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 4Hz).

MS: m/e (ESI) 507. 3 (MH⁺)

実施例 723

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸
エチルエステル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 00-1. 14 (4H, m), 1. 17 (3H, d, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 80-1. 97 (4H, m), 1. 99-2. 12 (2H, m), 2. 26-2. 37 (1H, m), 2. 43-2. 55 (2H, m, DMSO, m), 3. 05-3. 18 (4H, m), 3. 75-3. 93 (2H, m), 4. 05 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 71 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 46 (1H, brs), 9. 65 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 547. 4 (MH⁺)

実施例 724

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペン
タン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 05-1. 14 (4H, m), 1. 16 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 63-2. 00 (8H, m), 2. 27-2. 42 (3H, m), 3. 06-3. 19 (4H, m), 3. 75-3. 93 (2H, m), 4. 04 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 71 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 45 (1H, brs), 9. 65 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 561.4 (MH⁺)

実施例 725

4-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 17 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 82-1. 96 (4H, m), 1. 99-2. 11 (2H, m), 2. 44-2. 55 (2H, m, DMSO, m), 3. 05-3. 18 (4H, m), 3. 78-3. 91 (5H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 05 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 45 (1H, s).

10 MS:m/e (ESI) 584.3 (MH⁺)

実施例 726

5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 16 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 62-1. 99 (8H, m), 2. 32-2. 43 (2H, m), 3. 03-3. 20 (4H, m), 3. 77-3. 92 (5H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 04 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 36 (2H, s), 7. 45 (1H, s), 9. 08 (1H, brs), 9. 29 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 598.4 (MH⁺)

20 実施例 727

4-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 17 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 04-2. 08 (2H, m), 2. 48-2. 53 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4.8Hz), 3. 89 (3H, s), 4. 04-4. 12 (4H, m), 4. 28 (2H, q, J=7.2Hz)

), 4. 85 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 50-7. 56 (2H, m), 8. 21 (1H, d, J=5. 2Hz), 8. 55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 568. 3 (MH⁺)

実施例 728

5 4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 17 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 03-2. 08 (2H, m), 2. 47-2. 53 (2H, m), 3. 88 (3H, s), 4. 04-4. 14 (6H, m), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 50 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 52 (1H, d, J=2. 0Hz)

MS:m/e (ESI) 573. 3 (MH⁺)

実施例 729

15 4-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 17 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 36 (9H, s), 2. 05-2. 08 (2H, m), 2. 45-2. 54 (2H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 89 (3H, s), 3. 96 (3H, s), 4. 04-4. 12 (4H, m), 4. 81 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 48-7. 54 (2H, m).

MS:m/e (ESI) 545. 3 (MH⁺)

実施例 730

25 4-{8-第3ブチル-6-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 78-1. 85 (2H, m), 2. 38 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 77 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 32-3. 38 (4H, m), 4. 04 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 23-4. 28 (2H, m), 4. 74 (1H, s), 5. 44 (1H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 22 (2H, s), 8. 08 (1H, s), 8. 38 (1H, d, J=4. 8 Hz).

5 MS:m/e (ESI) 578. 4 (MH⁺)

実施例 731

4-{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジンを-4-イル}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 15 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 78-1. 84 (2H, m), 2. 38 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 30-3. 38 (4H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 98 (3H, s), 4. 04 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 23-4. 28 (2H, m), 4. 80 (1H, s), 5. 47 (1H, s), 7. 21 (2H, s), 7. 36 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 556. 3 (MH⁺)

15 実施例 732

4-{(3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル)-メチル-アミノ}-酪酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 16 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 41 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 65 (2H, quint, J=7. 2Hz), 2. 36 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 56 (3H, s), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 91 (1H, t, J=7. 2Hz), 4. 03 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 29 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 7. 77 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 22 (1H, s), 9. 86 (1H, s).

実施例 733

25 2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-{[3-(ヒドロキシメチル-カルバモイル)-プロピル]-メチル-アミノ}-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-

2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 41 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 62 (2H, quint, J=7. 2Hz), 2. 10 (2H, t, J=7. 2Hz),
2. 57 (3H, s), 2. 84 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 87 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 29 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 47
(2H, t, J=6. 0Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 46 (2H, d), 5. 51 (1H, t, J=6. 0Hz) 7. 55 (1H, s), 7. 68 (1
H, s), 7. 75 (1H, s), 8. 23 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 46 (1H, t, J=6. 0Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 17 (1H
, s), 9. 83 (1H, s).

実施例 734

10 2-[2-(7-第 3 ブチル-2-メチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-オキソ-エチ
ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチ
ルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 49 (9H, s), 2. 72 (3H, s), 2. 85 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 30 (2H, q, J=
6. 8Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 61 (2H, s), 7. 57 (1H, s), 7. 85 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 23 (1H, q, J=4
. 4Hz), 8. 28 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 59 (1H, s), 9. 26 (1H, s), 9. 89 (1H, s).

実施例 735

20 {5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-1,3,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-2-イ
ル}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 072 (6H, s), 1. 202 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 401 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 57-2. 74 (2H, m), 2. 815
(3H, d, J=4. 8Hz), 3. 608 (1H, t, J=6. 4Hz), 4. 116 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 265 (2H, d, J=6. 8H
z), 4. 830 (2H, s), 5. 381 (2H, s), 6. 608 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 516 (1H, s), 7. 612 (1H, d, J=
1. 6Hz), 7. 785 (1H, dd, J=1. 6, 8. 4Hz), 8. 213 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 537 (1H, s), 9. 224 (1H
, s), 9. 814 (1H, s).

実施例 736

, brs), 8.56 (1H, br), 9.36 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 595.5 (MH⁺)

実施例 739

5 [2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.08-1.10 (4H, m), 1.23 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.77-1.84 (1H, m), 1.97-2.05 (1H, m), 2.29-2.35 (1H, m), 2.93 (1H, brd, J=10.0Hz), 3.02-3.09 (1H, m), 3.26-3.42 (2H, m), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.33 (1H, brs), 4.49 (2H, ABq, J=15.6Hz), 4.82 (2H, s), 5.81 (2H, s), 7.40 (1H, s), 7.46 (1H, s), 7.72 (1H, d, J=8.4Hz), 8.09 (1H, d, J=8.4Hz), 9.60 (1H, br), 9.67 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 535.3 (MH⁺)

実施例 740

15 [2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.19 (3H, J=6.8Hz), 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, brs), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.93-2.02 (1H, m), 2.10-2.19 (1H, m), 2.92 (1H, dd, J=4.0, 10.0Hz), 2.99-3.04 (1H, m), 3.12 (1H, dd, J=7.6, 15.6Hz), 3.44 (1H, dd, J=6.4, 10.0Hz), 4.01 (1H, q, J=6.8Hz), 4.12 (2H, q, J=6.8Hz), 4.15 (2H, s), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.28 (1H, br), 4.78 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.59 (1H, s), 7.63 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 600.5 (MH⁺)

25 実施例 741

[1-(3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ

ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン
-3-イルオキシ)-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 18 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 39 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 94-2. 02 (1H, m), 2. 11-2. 18 (1H, m), 2. 82 (3H, d, J=3. 6Hz), 2. 94-2. 98 (1H, m), 3. 03-3. 09 (1H, m), 3. 12-3. 19 (1H, m), 3. 45-3. 49 (1H, m), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 16 (2H, s), 4. 25 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 62 (1H, s), 7. 66 (1H, s), 8. 21 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 38 (1H, br), 9. 93 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 595. 4 (MH⁺)

10 実施例 742

(1-(3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル)-ピロリジン-3-イ
ルオキシ)-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 08-1. 10 (4H, m), 1. 18 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 96-2. 03 (1H, m), 2. 12-2. 17 (1H, m), 2. 28-2. 34 (1H, m), 2. 98 (1H, brd, J=9. 2Hz), 3. 06-3. 11 (1H, m), 3. 13-3. 19 (1H, m), 3. 49 (1H, dd, J=5. 2, 9. 6Hz), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 16 (2H, s), 4. 30 (1H, brs), 4. 82 (2H, s), 5. 58 (2H, s), 7. 62 (1H, s), 7. 67 (1H, s), 7. 71 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 61 (1H, brs), 9. 66 (1H, brs).

- 20 MS:m/e (ESI) 535. 3 (MH⁺)

実施例 743

2,2-ジメチルプロピオン酸2-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチ
ルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジ
ン-1-イル)-フェノキシ)-アセトキシメチルエステル;臭化水素酸塩

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 15 (9H, s), 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 84-1. 89 (4H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8

Hz), 3.06-3.12 (4H, m), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz), 4.58 (2H, s), 4.83 (2H, s), 5.49 (2H, s), 5.83 (2H, s), 7.43 (1H, s), 7.49 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s), 9.15 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 665.4 (MH⁺)

5 実施例 744

2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(1,2,3,3-テトラメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-エタノン;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.02 (3H, s), 1.14 (3H, d, J=6.4Hz), 1.21-1.30 (9H, m), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.79 (3H, s), 3.10-3.20 (1H, m), 4.10 (2H, q, J=6.8Hz), 4.19 (2H, q, J=6.8Hz), 4.76 (2H, s), 5.33 (2H, s), 6.59 (1H, d, J=8.4Hz), 7.31 (1H, s), 7.60 (1H, s), 7.75 (1H, d, J=8.4Hz).

MS:m/e (ESI) 454.2 (MH⁺)

実施例 745

- 15 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.27 (3H, t, J=7Hz), 1.31 (3H, t, J=7Hz), 1.39 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.95-3.01 (4H, m), 3.69-3.77 (4H, m), 4.13 (2H, q, J=7z), 4.23 (2H, q, J=7Hz), 4.25 (2H, q, J=7Hz), 4.81 (2H, s), 4.92 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.66 (1H, s), 9.08 (1H, brs), 9.33 (1H, brs).

実施例 746

- 25 (1-(3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル)-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 86-1. 96 (1H, m), 2. 02-2. 12 (1H, m), 2. 89-2. 95 (1H, m), 3. 01-3. 18 (2H, m), 3. 36-3. 42 (1H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 3. 99 (2H, brs), 4. 23-4. 27 (1H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 47 (2H, d, J=7. 2Hz), 7. 35 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 7. 70 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 544. 4 (MH⁺)

実施例 747

1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 19 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 96-2. 02 (1H, m), 2. 11-2. 19 (1H, m), 2. 94-2. 97 (1H, m), 3. 02-3. 09 (1H, m), 3. 12-3. 18 (1H, m), 3. 47 (1H, dd, J=6. 0, 10. 4Hz), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 27-4. 32 (1H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 60 (1H, s), 7. 65 (1H, s), 9. 09 (1H, s), 9. 45 (1H, s).

15 MS:m/e (ESI) 572. 3 (MH⁺)

実施例 748

3-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-プロパン酸 メチルエステル;塩酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 41 (9H, s), 2. 84 (2H, t, J=7. 2Hz), 3. 19-3. 27 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 31 (2H, brs), 4. 80 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 86 (1H, s), 8. 10 (1H, s), 9. 08 (1H, s), 9. 13-9. 17 (1H, m), 9. 45 (1H, s), 10. 20 (1H, s).

25 MS:m/e (ESI) 544. 3 (MH⁺)

実施例 749

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 29 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 88-1. 98 (1H, m), 2. 13-2. 21 (2H, m), 2. 28-2. 38 (1H, m), 3. 78-3. 84 (1H, m), 4. 12 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 20 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 23 (1H, brs), 4. 71 (1H, d, J=14.4Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 7. 32 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 7. 73 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 570. 4 (MH⁺)

10 実施例 750

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸 メチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 29 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 02-2. 09 (1H, m), 2. 32-2. 45 (3H, m), 3. 64 (3H, s), 4. 12 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 20 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 29 (1H, d, J=17.6Hz), 4. 39-4. 45 (1H, m), 4. 63 (1H, d, J=14.4Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 49 (2H, d, J=8.4Hz), 7. 33 (1H, s), 7. 72 (1H, s), 7. 78 (1H, s), 9. 06 (1H, s), 9. 46 (1H, s), 10. 03 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 584. 3 (MH⁺)

20 実施例 751

(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 35 (9H, s), 1. 96 (3H, s), 2. 49 (2H, s), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 39 (2H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 76 (1H, s), 7. 88 (1H, s), 8. 31 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 530. 2 (MH⁺)

実施例 752

(4-(3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジル)-ピペラジン-1-イル)-酢酸

5 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 16 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 32 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 35-2. 55 (8H, m), 2. 82 (3H
 , d, J=4. 0Hz), 3. 18 (2H, s), 3. 56 (2H, s), 4. 05 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz),
 4. 86 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 67 (1H, s), 7. 75 (1H, s), 7. 87 (1H, s), 8. 21 (1
 10 H, d, J=4. 0), 8. 56 (1H, s), 9. 28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 592. 5 (MH⁺)

実施例 753

{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-メトキシカルボニルイミノ-6-メチルカルバ
モイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イ
 15 ル)-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 32 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 41 (9H, s), 1. 55 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 88-1. 95 (4H, m), 3. 01 (3H
 , d, J=4. 8Hz), 3. 08-3. 25 (4H, m), 3. 85 (3H, s), 4. 19-4. 35 (4H, m), 4. 51 (2H, s), 4. 62 (2
 H, s), 5. 10 (2H, s), 6. 99 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 64-7. 73 (1H, m), 8. 81 (1H
 20 . s).

MS:m/e (ESI) 637. 4 (MH⁺)

実施例 754

2-[2-(7-第 3 ブチル-2-メトキシメチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-オキソ-
エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
 25 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 45 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 50 (9H, s), 2. 86 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 47 (3H, s), 4. 31 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 82 (2H, s), 4. 92 (2H, s), 5. 63 (2H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 91 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 23 (1H, m), 8. 39 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 61 (1H, s), 9. 30 (1H, m), 9. 92 (1H, m).

実施例 755

- 5 7-第3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾオキサゾール e-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 52 (9H, s), 2. 85 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 29 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 49 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 92 (2H, s), 5. 63 (2H, s), 7. 57 (1H, s), 8. 02 (1H, s), 8. 24 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s), 8. 60 (1H, s), 9. 28 (1H, s), 9. 91 (1H, s).

実施例 756

- 15 {3-第3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジルオキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (2H, d, J=4. 8), 4. 13 (2H, s), 4. 26 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 64 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 75 (1H, s), 7. 82 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 24 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs).

- 20 実施例 757

2-{2-[3-第3 ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 42 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 11 (2H, m), 2. 85 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 12 (2H, t, J=5. 6Hz), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 55 (2H, s), 8.

22 (1H, m), 8.59 (1H, s), 9.21 (1H, m), 9.86 (1H, m).

実施例 758

2-(2-{3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-[3-(2-メトキシ-エトキシ)-プロポキシ]-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.45 (9H, s), 1.53 (3H, t, J=7.2Hz), 2.11 (2H, m), 3.30 (3H, s), 3.54 (2H, m), 3.61 (2H, m), 3.69 (2H, t, J=7.2Hz), 4.22 (4H, m), 4.36 (2H, q, J=7.2Hz), 4.90 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.48 (1H, sz), 7.52 (1H, s), 7.67 (1H, s), 8.54 (1H, s).

10 実施例 759

{4-[2-(1-アセトキシメトキシカルボニルイミノ-5-エトキシ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-第 3 ブチル-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.33 (3H, t, J=7.2Hz), 1.42 (9H, s), 1.55 (3H, t, J=7.2Hz), 1.87-1.97 (4H, m), 2.15 (3H, s), 3.00 (3H, d, J=4.8Hz), 3.11-3.22 (4H, m), 4.18-4.36 (4H, m), 4.51 (2H, s), 4.64 (2H, s), 5.14 (2H, s), 5.88 (2H, s), 6.99 (1H, s), 7.44 (1H, s), 7.50-7.65 (2H, m), 8.88 (1H, s).

実施例 760

20 1-{3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.10 (3H, t, J=7Hz), 1.41 (9H, s), 1.54 (3H, t, J=7Hz), 1.91-2.13 (3H, m), 2.45 (1H, q, J=7Hz), 3.13 (3H, d, J=5Hz), 3.32 (1H, br. t, J=7Hz), 3.74 (1H, br. t, J=7Hz), 3.75 (3H, s), 4.01 (1H, qd, J=7, 2Hz), 4.02 (1H, qd, J=7, 2Hz), 4.46 (2H, brs), 4.58 (1H, t, J=7Hz),

4. 86 (2H, s), 6. 12 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 61 (1H, d, J=2Hz), 7. 66 (1H, d, J=2Hz), 8. 30 (1H, m), 9. 50 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 579. 0 (MH⁺)

実施例 761

- 5 1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 24 (6H, t, J=7Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 53 (3H, t, J=7Hz), 1. 92-2. 12 (3H, m), 2. 42-2. 49 (1H,), 3. 35 (1H, t, J=6Hz), 3. 71 (1H, t, J=6Hz), 3. 73 (3H, s), 4. 01 (2H, m), 4. 18 (4H, q, J=7Hz), 4. 60 (1H, t, J=6Hz), 4. 77 (2H, s), 6. 09 (2H, s), 6. 85 (1H, s), 7. 62 (2H, s).

MS:m/e (ESI) 584. 0 (MH⁺)

実施例 762

- 15 1-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 11 (3H, t, J=7Hz), 1. 15-1. 25 (4H, m), 1. 40 (9H, s), 1. 92-2. 11 (4H, m), 2. 15-2. 21 (1H, m), 2. 41-2. 49 (1H, m), 3. 35 (1H, t, J=7Hz), 3. 71 (1H, t, J=7Hz), 3. 73 (3H, s), 4. 01 (1H, qd, J=7, 4Hz), 4. 02 (1H, qd, qd, J=7, 4Hz), 4. 60 (1H, t, J=7Hz), 4. 82 (2H, s), 6. 20 (2H, s), 7. 54 (1H, d, J=8Hz), 7. 63 (1H, d, J=2Hz), 7. 64 (1H, d, J=2Hz), 7. 79 (1H, d, J=8Hz).

MS:m/e (ESI) 519. 0 (MH⁺)

実施例 763

- 25 {4-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 24 (3H, t, 7Hz), 1. 41 (3H, t, J=7Hz), 1. 57 (9H, s), 2. 84 (3H, d, J=5Hz), 4. 19 (2H, q, J=7H), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 89 (2H, s), 5. 37 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 71 (1H, d, =2Hz), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 8. 26 (1H, d, J=2Hz), 8. 44 (1H, s), 8. 57 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 534. 0 (MH⁺)

実施例 764

{4-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸 エチルエス
テル;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 21 (3H, t, J=7Hz), 1. 42 (3H, t, J=7Hz), 1. 55 (3H, t, J=7Hz), 1. 60 (9H, s), 4. 18-4. 25 (4H, m), 4. 23 (2H, q, J=7Hz), 5. 02 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 6. 14 (2H, s), 6. 90 (1H, s), 7. 00 (1H, s), 7. 98 (1H, s), 8. 54 (1H, brs), 8. 99 (1H, brs), 10. 78 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 539. 0 (MH⁺)

15 実施例 765

{4-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]
ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸 エチルエステ
ル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 12-1. 24 (4H, m), 1. 35 (3H, t, J=7Hz), 1. 60 (9H, s), 2. 17-2. 24 (1H, m), 4. 32 (2H, q, J=7Hz), 5. 05 (2H, s), 5. 29 (2H, s), 6. 23 (2H, s), 7. 31 (1H, brs), 7. 37 (1H, d, J=8Hz), 7. 82 (1H, d, J=2Hz), 7. 84 (1H, d, J=8Hz), 8. 08 (1H, s), 8. 85 (1H, d, J=2Hz).

MS:m/e (ESI) 474. 0 (MH⁺)

実施例 766

25 2-{2-[3-第3ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メトキシ-フェニル]-2-
オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドール

-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1. 39 (9H, s), 1. 95-2. 04 (2H, m), 2. 23-2. 30 (2H, m), 2. 79 (3H, d, J=5Hz), 2. 93 (6H, s), 3. 89 (2H, s), 4. 05-4. 11 (2H, m), 4. 76 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 17 (1H, s), 7. 34 (1H, brs), 7. 52 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 8. 09 (1H, s), 8. 38 (1H, q, J=5Hz).

実施例 767

2-[2-[7-第 3 ブチル-2-(2-シアノ-エチル)-ベンゾオキサゾール-5-イル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 10 1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1. 44 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 50 (9H, s), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 12 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 45 (2H, t, J=6. 4Hz), 4. 31 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 91 (2H, s), 5. 61 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 88 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 23 (1H, m), 8. 37 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 60 (1H, s), 9. 28 (1H, m), 9. 90 (1H, m).

- 15 実施例 768

2-[2-[7-第 3 ブチル-2-(2-カルバモイル-エチル)-ベンゾオキサゾール-5-イル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

- 20 1. 44 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 49 (9H, s), 2. 71 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 23 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 91 (2H, s), 5. 60 (2H, s), 6. 93 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 84 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 23 (1H, m), 8. 28 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 60 (1H, s), 9. 28 (1H, m), 9. 91 (1H, m).

実施例 769

- 25 3-[7-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-アセチル]-ベンゾオキサゾール-2-イル]-プロパン

酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 49 (9H, s), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 88 (2H, t, J=7. 6Hz), 3. 27 (2H, t, J=7. 6Hz), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 91 (2H, s), 5. 59 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 85 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 23 (1H, m), 8. 31 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 60 (1H, s), 9. 28 (1H, m), 9. 90 (1H, m).

実施例 770

- 2-{2-[3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(3-メチルカルバモイル-プロポキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 1. 97-2. 06 (2H, m), 2. 26-2. 35 (2H, m), 2. 58 (3H, d, J=5Hz), 2. 84 (3H, d, J=5Hz), 4. 03-4. 10 (2H, m), 4. 29 (2H, q, J=7Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 72 (1H, q, J=5Hz), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 57 (1H, s).

実施例 771

- 2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-ジメチルカルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 1. 96-2. 06 (2H, m), 2. 52-2. 59 (2H, m), 2. 83 (3H, s), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 2. 98 (3H, s), 4. 06-4. 14 (2H, m), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s).

実施例 772

- 2-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(3-メチルカルバモイル-プロポキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール

-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 1. 98-2. 08 (2H, m), 2. 26-2. 33 (2H, m), 2. 57 (3H, d, J=5Hz), 2. 84 (3H, d, J=5Hz), 3. 92 (3H, s), 4. 05-4. 12 (2H, m), 4. 29 (2H, q, J=7Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 56 (2H, s), 7. 78-7. 88 (1H, m), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s).

実施例 773

2-[2-[3-第 3 ブチル-5-(3-ジメチルカルバモイル-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 1. 98-2. 08 (2H, m), 2. 45-2. 56 (2H, m), 2. 83 (3H, s), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 2. 98 (3H, s), 3. 92 (3H, s), 4. 08-4. 16 (2H, m), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 55 (3H, s), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s).

実施例 774

2-[2-(7-第 3 ブチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 50 (9H, s), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 31 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 91 (2H, s), 5. 62 (2H, s), 7. 57 (1H, s), 7. 93 (1H, s), 8. 23 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 45 (1H, s), 8. 59 (1H, s), 8. 98 (1H, s), 9. 26 (1H, s), 9. 90 (1H, s).

実施例 775

{5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-7-メトキシ-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-イソインドール-1-イル}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (6H, s), 1. 44 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 76 (3H, s), 4. 27 (2H, s), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 39 (2H, s), 7. 32 (1H, d, J=1. 2Hz), 7. 42 (1H, d, J=1. 2Hz), 7. 55 (1H, s), 8. 22 (1H, m), 8. 58 (1H, s), 9. 21 (1H, m), 9. 83 (1H, m).

5 実施例 776

2-[2-[3-(3-カルバモイル-プロポキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-インソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 1. 90-2. 01 (2H, m), 2. 21-2. 28 (2H, m), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 4. 03-4. 10 (2H, m), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 03 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 29-7. 37 (2H, m), 7. 48-7. 57 (3H, m), 7. 49-7. 54 (1H, m), 8. 23 (1H, q, J=5Hz), 8. 59 (1H, s).

実施例 777

15 {2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-インソインドール-2-イル]-アセチル}-6-メトキシフェニルアミノ}-酢酸; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 40 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 88 (3H, s), 3. 77 (3H, s), 3. 99 (2H, s), 4. 27 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 32 (2H, s), 7. 38 (1H, dd, J=7. 2, 1. 6Hz), 7. 60 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 45 (1H, s).

実施例 778

{(2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-インソインドール-2-イル]-アセチル)-6-メトキシフェニル}-メチルアミノ}-酢酸; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (3H, t, J=6.4Hz), 1.44 (9H, s), 2.67 (3H, s), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.28 (1H, d, J=20Hz) 4.05 (1H, d, J=20Hz), 4.28 (2H, q, J=6.4Hz), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.47 (1H, d, J=2.0Hz) 7.54 (1H, s), 7.58 (1H, d, J=2.0Hz), 8.20 (1H, q, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s), 9.16-9.20 (1H, m), 9.83-9.88 (1H, m).

5 実施例 779

2-[2-(7-第3ブチル-3-シアノメチル-3H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1.42 (3H, t, J=7Hz), 1.57 (9H, s), 2.85 (3H, d, J=4Hz), 4.29 (2H, q, J=7Hz), 4.91 (2H, s), 5.49 (2H, s), 5.74 (2H, s), 7.56 (1H, s), 7.78 (1H, d, J=1Hz), 8.22 (1H, q, J=4Hz), 8.39 (1H, d, J=1Hz), 8.56 (1H, s), 8.59 (1H, s), 9.28 (1H, s), 9.48 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 487.0 (MH⁺)

実施例 780

15 {4-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イン-インドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.30 (3H, t, J=7Hz), 1.40 (3H, t, J=7Hz), 1.55 (9H, s), 4.13 (2H, q, J=7Hz), 4.22 (2H, q, J=7Hz), 4.84 (2H, s), 5.48 (2H, s) 5.75 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.77 (1H, d, J=2Hz), 8.37 (1H, d, J=2Hz), 8.56 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 492.0 (MH⁺)

実施例 781

25 {4-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 05-1. 16 (4H, m), 1. 56 (9H, s), 2. 30-2. 37 (1H, m), 4. 89 (2H, s), 5. 65 (2H, s), 5. 74 (2H, s), 7. 74 (1H, d, J=8Hz), 7. 78 (1H, d, J=2Hz), 8. 12 (1H, d, J=8Hz), 8. 39 (1H, d, J=2Hz), 8. 57 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 427. 0 (MH⁺)

実施例 782

2-{2-[3-アセチルアミノ-5-第3ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インゾール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36-1. 43 (12H, s), 2. 01-2. 07 (2H, m), 2. 13 (3H, s), 2. 27 (2H, t, J=7. 2), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 87 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 28 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 6. 86 (1H, s), 7. 38 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 70 (1H, d, J=2. 0), 8. 17-8. 23 (2H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 65 (1H, s), 9. 83 (1H, s).

15 MS:m/e (ESI) 566. 3 (MH⁺)

実施例 783

2-{2-[3-第3ブチル-4-(3-シアノ-プロポキシ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インゾール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 17 (2H, m), 2. 73 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 85 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 23 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 22 (1H, d, J=9. 2Hz), 7. 55 (1H, s), 7. 87 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 94 (1H, dd, J=2. 0, 9. 2Hz), 8. 22 (1H, m), 8. 59 (1H, s).

25 実施例 784

2-[2-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキ

シ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インゾール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.34 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=6.8Hz), 2.84 (3H, d, J=4.4Hz), 2.99 (6H, s), 4.29 (2H, q, J=6.8Hz), 4.88 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.06 (1H, s), 7.12 (1H, s), 7.34 (1H, s), 7.56 (1H, s), 8.23 (1H, q, J=4.4Hz), 8.58 (1H, s), 9.24 (1H, s), 9.85 (1H, s).

実施例 785

(1-{3-第3ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;塩酸塩

10

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.20-1.50 (12H, m), 1.93-2.07 (1H, m), 2.10-2.23 (1H, m), 2.77 (3H, d, J=5.1Hz), 2.94-3.05 (1H, m), 3.06-3.24 (2H, m), 3.43-3.54 (1H, m), 4.07 (3H, s), 4.14-4.55 (5H, m), 4.87 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.61 (1H, s), 7.69 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.52-8.62 (1H, s), 9.54 (1H, brs), 9.95 (1H, brs).

15

実施例 786

3-(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-プロパン酸;塩酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.23-1.46 (12H, m), 2.16 (3H, s), 2.60-2.83 (5H, m), 3.51-3.69 (2H, m), 4.15-4.32 (2H, m), 4.48 (2H, brs), 4.88 (2H, brs), 5.57 (2H, brs), 7.81 (1H, s), 7.93 (2H, brs), 7.99 (1H, brs), 8.55-8.64 (1H, m), 9.97 (1H, brs).

実施例 787

25 4-[2-第3ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(2-オキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェノキシ]-ブ

チルアミド;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 73 (4H, br), 2. 02 (2H, br), 2. 27 (2H, t, J=7. 6Hz), 2. 58 (3H, s), 3. 14 (2H, br), 3. 24-3. 40 (2H, br), 3. 83 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 53 (2H, s), 4. 60 (2H, s), 5. 15 (2H, s), 6. 81 (1H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 46 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 56 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 87 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 95 (1H, d, J=8. 0Hz).

MS:m/e (ESI) 534. 3 (MH⁺)

実施例 788

- 2-[2-(7-第 3 ブチル-3H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;ト

リフルオロ酢酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 43 (3H, t, J=7Hz), 1. 54 (9H, s), 2. 74 (3H, d, J=5Hz), 4. 29 (2H, q, J=7Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 59 (2H, s), 7. 57 (1H, s), 7. 70 (1H, s), 8. 16 (1H, brs), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 45 (1H, s), 8. 57 (1H, s), 9. 23 (1H, s), 9. 45 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 448. 0 (MH⁺)

実施例 789

- 2-[2-(7-第 3 ブチル-3-メチル-3H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 42 (3H, t, J=7Hz), 1. 55 (9H, s), 2. 74 (3H, d, J=4Hz), 3. 94 (3H, s), 4. 29 (2H, q, J=7Hz), 4. 89 (2H, s), 5. 60 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 71 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=4Hz), 8. 23 (1H, s), 8. 42 (1H, s), 8. 58 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 462. 0 (MH⁺)

実施例 790

2-[2-(7-第3ブチル-3-カルバモイルメチル-3H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-2-
オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル
ボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 5 1.42(3H, t, J=7Hz), 1.58(9H, s), 2.83(3H, d, J=5Hz), 4.29(2H, q, J=7Hz), 4.89(2H, s),
5.13(2H, s), 5.57(2H, s), 7.38(1H, s), 7.55(1H, s), 7.70(1H, d, J=2Hz), 7.82(1H, s),
8.12(1H, d, J=2Hz), 8.22(1H, q, J=5Hz), 8.39(1H, s), 8.58(1H, s), 9.26(1H, d, J=4Hz),
9.85(1H, d, J=4Hz).

MS:m/e (ESI) 505.0 (MH⁺)

10 実施例 791

2-[4-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル]-アセトアミド;
臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 15 1.28(3H, t, J=7Hz), 1.40(3H, t, J=7Hz), 1.56(9H, s), 4.12(2H, q, J=7Hz), 4.22(2H, q,
J=7Hz), 4.84(2H, s), 5.03(2H, s), 5.55(2H, s), 7.36(1H, s), 7.39(1H, s), 7.67(1H, s),
7.82(1H, s), 8.10(1H, s), 8.39(1H, s), 9.04(1H, brs), 9.39(1H, brs).

MS:m/e (ESI) 510.0 (MH⁺)

実施例 792

20 2-[4-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル]-アセトアミ
ド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 25 1.05-1.13(4H, m), 2.33(1H, quint, J=7Hz), 1.57(9H, s), 4.86(2H, s), 5.03(2H, s), 5.
62(2H, s), 7.38(1H, s), 7.70(1H, s), 7.73(1H, d, J=8Hz), 7.81(1H, s), 8.10(1H, d, J=8
Hz), 8.11(1, s), 8.39(1H, s), 9.53(1H, brs), 9.66(1H, brs).

MS: m/e (ESI) 445. 0 (MH⁺)

実施例 793

2-[2-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (12H, m), 2. 63 (6H, s), 2. 84 (2H, s), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 66 (1H, s), 7. 71 (1H, s), 8. 22 (1H, s), 8. 57 (1H, s), 9. 17 (1H, s), 9. 84 (1H, s).

10 実施例 794

4-[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 01-1. 15 (4H, m), 1. 37 (9H, s), 1. 82-2. 08 (6H, m), 2. 28-2. 43 (3H, m), 2. 82-3. 42 (4H, ndH₂O. m), 3. 78-3. 94 (2H, m), 4. 81 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 68-7. 75 (1H, m), 8. 06-8. 12 (1H, m), 9. 44 (1H, brs), 9. 66 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 519. 3 (MH⁺)

実施例 795

20 5-[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 00-1. 15 (4H, m), 1. 38 (9H, s), 1. 59-1. 85 (4H, m), 2. 23-2. 37 (3H, m), 3. 03-3. 20 (4H, m), 3. 78-3. 88 (2H, m), 4. 81 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 41-9. 49 (1H, m), 9. 61-9. 70 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 533. 3 (MH⁺)

実施例 796

4-{4-[2-(1-アミノ-7-フルオロ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-第 3 ブチル-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸;

5 トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 79-1. 96 (4H, m), 2. 01 (2H, t, J=6. 8Hz), 2. 41 (2H, t, J=7. 2Hz), 3. 02-3. 20 (4H, m), 3. 77-3. 90 (5H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 35 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 36 (1H, s), 7. 45 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 03-9. 11 (1H, m), 9. 27-9. 34 (1H, m).

10 実施例 797

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 38 (9H, s), 1. 55-1. 99 (8H, m), 2. 17-2. 36 (2H, m), 2. 94-3. 20 (4H, m), 3. 57-4. 27 (8H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 36 (2H, s), 7. 45 (1H, s), 9. 01-9. 11 (1H, m), 9. 22-9. 35 (1H, m).

実施例 798

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 41 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 13 (2H, m), 2. 75 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 80 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 11-4. 19 (4H, m), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 76 (2H, m), 7. 59 (1H, s), 8. 22 (1H, m), 8. 59 (1H, s), 9. 21 (1H, m).

25 実施例 799

2,6-ジ第3 ブチル-4-[1-ヒドロキシ-2-(3-イミノ-5,6-ジメトキシ-3H-ベンゾ[d]
イソキサゾール-2-イル)-ビニル]-フェノール;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 45 (1H, s), 3. 90 (3H, s), 4. 07 (3H, s), 5. 96 (1H, s), 6. 27 (1H, brs), 6. 52 (1H, s), 7. 8
4 (1H, s), 7. 98 (2H, s), 9. 55-9. 66 (2H, m), 9. 80 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 441. 1 (MH⁺)

実施例 800

2-[2-(3-第3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-オキシ
-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (12H, m), 1. 94 (4H, s), 2. 84 (3H, s), 3. 02 (4H, s), 4. 30 (2H, q, 6. 4Hz), 4. 86 (2H, s)
, 5. 48 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 62 (1H, s), 7. 65 (1H, s), 8. 23 (1H, s), 8. 57 (1H, s), 9. 18 (
1H, s), 9. 84 (1H, s).

実施例 801

({3-第3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 32 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 06 (3H, s), 4. 21 (2H, s), 4
. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 01 (1H, s), 7. 07 (1H, s), 7. 35 (1H, s)
, 7. 55 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 33 (1H, s), 9. 89 (1H, s).

実施例 802

({3-第3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸 エチル
エステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 18 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 32 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 08 (3H, s), 4. 10 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 32 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 00 (1H, s), 7. 08 (1H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 23 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 30 (1H, s), 9. 88 (1H, s).

5 実施例 803

4-{3-第 3 プチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(3-ヒドロキシメチル-7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 38 (9H, s), 1. 95-2. 05 (2H, m), 2. 28 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 57 (3H, s), 4. 04-4. 10 (2H, m), 4. 68 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 03 (1H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 28 (1H, s), 7. 44 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 52 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 19 (1H, s), 9. 45-9. 51 (1H, m), 9. 84-9. 90 (1H, m).

実施例 804

15 4-{2-第 3 プチル-4-[2-(3-ヒドロキシメチル-7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 38 (9H, s), 1. 85-1. 92 (4H, m), 2. 01 (2H, m), 2. 40 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 57 (3H, s), 3. 08-3. 15 (4H, m), 3. 85 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 69 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 5. 67 (1H, s), 7. 36 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 46 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 20 (1H, s).

実施例 805

25 4-{(2-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル)-メチル-アミノ}-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 04-1. 12 (4H, m), 1. 42 (9H, s), 1. 70-1. 82 (2H, m), 2. 44 (2H, t, J=7. 6Hz), 2. 52 (3H, s), 2. 70-2. 80 (2H, m), 4. 83 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 58 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 71 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 90 (1H, dd, J=8. 4, 2. 0Hz), 7. 94 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 09 (1H, dd, J=8. 4Hz), 9. 44-9. 50 (1H, m), 9. 63-9. 68 (1H, m).

5 実施例 806

4-((2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル)-メチル-アミノ)-酪酸;トリフル
オロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 43 (9H, s), 1. 70-1. 82 (2H, m), 2. 24 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 51 (3H, s), 2. 70-2. 80 (2H, m), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 57 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 88 (1H, d, J=8. 4 Hz), 7. 93 (1H, s), 9. 04 (1H, brs), 9. 29 (1H, brs).

実施例 807

- 15 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-イミノ-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 48 (18H, s), 1. 60 (6H, m), 5. 77 (2H, s), 7. 27 (1H, t, J=7. 2Hz), 7. 35 (1H, t, J=7. 2Hz), 7. 40 (1H, d, J=7. 2Hz), 7. 54 (1H, d, J=7. 2Hz), 7. 58 (2H, s), 8. 10 (1H, brs), 9. 88 (1H, br s), 10. 04 (1H, brs).

実施例 808

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチル
ルアミド;臭化水素酸塩

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (12H, m), 2. 77 (6H, s), 2. 84 (3H, s), 3. 85 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H,

s), 5.52 (2H, s), 7.48 (1H, s), 7.56 (2H, s), 8.22 (1H, s), 8.57 (1H, s), 9.18 (1H, s), 9.85 (1H, s).

実施例 809

5 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1.17 (3H, t, J=7.2Hz), 1.37 (9H, s), 1.65-1.83 (4H, m), 2.05-2.19 (2H, m), 2.39 (2H, t, J=6.6Hz), 2.69 (2H, t, J=6.8Hz), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.00-4.19 (6H, m), 4.81 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.37 (1H, s), 7.52 (1H, s), 7.55 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 612.3 (MH⁺)

実施例 810

15 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1.17 (3H, t, J=7.0Hz), 1.28-1.44 (12H, m), 1.67-1.84 (4H, m), 2.06-2.17 (2H, m), 2.39 (2H, t, J=6.8Hz), 2.69 (2H, t, J=7.0Hz), 2.77 (3H, d, J=3.6Hz), 3.99-4.18 (6H, m), 4.24 (2H, t, J=6.8Hz), 4.88 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.52 (1H, s), 7.56 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.47-8.58 (1H, m), 9.44 (1H, brs), 9.96 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 636.3 (MH⁺)

実施例 811

25 4-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 16 (3H, t, J=6.8Hz), 1.25-1.47 (12H, m), 1.88 (4H, brs), 1.98-2.10 (2H, m), 2.42-2.55 (2H, m), 2.77 (3H, brs), 3.11 (4H, brs), 3.65-3.88 (2H, m), 4.05 (2H, q, J=6.8Hz), 4.24 (2H, q, J=6.8Hz), 4.87 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.45 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.50-8.58 (1H, m), 9.44 (1H, brs), 9.94 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 608.3 (MH⁺)

実施例 812

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸 エチルエステル;塩酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.16 (3H, t, J=7.0Hz), 1.26-1.45 (12H, m), 1.62-1.85 (4H, m), 1.88 (4H, brs), 2.37 (2H, t, J=6.8Hz), 2.77 (3H, brs), 3.12 (4H, brs), 3.78-3.91 (2H, m), 3.95-4.10 (2H, m), 4.12-4.32 (2H, m), 4.87 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.36 (1H, brs), 7.46 (1H, brs), 7.99 (1H, s), 8.53 (1H, q, J=4.4Hz), 9.35-9.46 (1H, m), 9.92-9.99 (1H, m).

15 MS:m/e (ESI) 622.3 (MH⁺)

実施例 813

ヘプタデカン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.83 (3H, t, J=7Hz), 1.15-1.28 (28H, m), 1.34 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7Hz), 1.61-1.70 (1H, m), 2.67 (2H, t, J=7Hz), 2.83 (3H, d, J=5Hz), 4.28 (2H, q, J=7Hz), 4.86 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.28 (1H, d, J=8Hz), 7.54 (1H, s), 7.93 (1H, d, J=8Hz), 7.98 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=5Hz), 8.57 (1H, s).

25 実施例 814

ヘプタデカン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ

-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 0.83 (3H, t, J=7Hz), 1.15-1.27 (28H, m), 1.29 (3H, t, J=7Hz), 1.33 (9H, s), 1.38 (3H, t, J=7Hz), 1.39 (3H, t, J=7Hz), 1.60-1.70 (2H, m), 2.67 (2H, t, J=7Hz), 4.11 (2H, q, J=7Hz), 4.20 (2H, q, J=7Hz), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.28 (1H, d, J=8Hz), 7.32 (1H, s), 7.92 (1H, d, J=8Hz), 7.97 (1H, s).

実施例 815

酢酸 2-[第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.33 (3H, t, J=7Hz), 1.15-1.30 (28H, m), 1.62-1.70 (2H, m), 2.32 (3H, s), 2.58 (3H, s), 2.68 (3H, t, J=7Hz), 3.99 (2H, q, J=7Hz), 4.84 (2H, s), 5.57 (2H, s), 7.29 (1H, d, J=8Hz), 7.94 (1H, d, J=8Hz), 7.98 (1H, s).

15 実施例 816

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-5,6-ジエトキシ-2,3-ジヒドロ-イソインドール-1-オン

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.45-1.52 (6H, m), 1.46 (9H, s), 4.10-4.19 (4H, m), 4.42 (2H, s), 5.00 (2H, s), 5.80 (1H, s), 6.91 (1H, s), 7.34 (1H, s), 7.90 (2H, s).

実施例 817

(1-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.08-1.11 (4H, m), 2.02-2.08 (2H, m), 2.29-2.34 (1H, m), 3.08-3.13 (2H, m), 3.15-3.4

2 (2H, m), 3. 65 (3H, s), 4. 05 (2H, s), 4. 26 (1H, br), 4. 82 (2H, s), 5. 55 (2H, d, J=4. 8Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 10 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 45 (1H, brs), 9. 66 (1H, brs).

実施例 818

- 5 (1-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸メチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 08-1. 10 (4H, m), 2. 01-2. 10 (2H, m), 2. 30-2. 33 (1H, m), 3. 11-3. 14 (2H, m), 3. 40-3. 4
10 4 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 65 (3H, m), 4. 17 (2H, s), 4. 26 (1H, br), 4. 82 (2H, s), 5. 56 (2H, d, J=4. 4Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 49 (1H, brs), 9. 66 (1H, brs).

実施例 819

- 15 [2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-酢酸エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 24 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 32-1. 45 (12H, m), 1. 99-2. 12 (2H, m), 2
20 . 66 (2H, t, J=7. 0Hz), 3. 98-4. 30 (8H, m), 4. 77 (2H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 9. 06 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 598. 3 (MH⁺)

実施例 820

- 5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 65-1. 75 (2H, m), 1. 78-1. 87 (2H, m), 2. 23-2. 37 (3H, m), 3. 87 (3H, s), 3.

95 (H, s), 4. 13 (2H, t, J=7Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 17 (1H, d, J=8Hz), 7. 35 (1H, s), 7. 83 (1H, d, J=2Hz), 7. 88 (1H, dd, J=2Hz, 8Hz), 9. 07 (1H, brs), 9. 35 (1H, brs).

実施例 821

5 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ペンタン酸;トリフルオロ酢
酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 05-1. 14 (4H, m), 1. 37 (9H, s), 1. 65-1. 75 (2H, m), 1. 78-1. 88 (2H, m), 2. 25-2. 37 (1H, m), 2. 30 (2H, t, J=7Hz), 4. 13 (2H, t, J=7Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 18 (1H, d, J=8 Hz), 7. 72 (1H, d, J=8Hz), 7. 84 (1H, s), 7. 91 (1H, d, J=8Hz), 8. 09 (1H, d, J=8Hz), 9. 51 (1 H, brs), 9. 65 (1H, brs).

実施例 822

15 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 63-1. 68 (2H, m), 1. 78-1. 82 (2H, m), 1. 91-1. 99 (1H, m), 2. 03-2. 12 (1H, m), 2. 29 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 05-3. 10 (2H, m), 3. 23 (3H, s), 3. 20-3. 38 (2H, m), 3. 73 (2H , q, J=4. 4Hz), 3. 86 (3H, s), 3. 94 (3H, s), 4. 04 (1H, brs), 4. 79 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 3 20 3 (1H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 9. 07 (1H, brs), 9. 30 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 600. 3 (MH⁺)

実施例 823

25 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-ペンタン酸 メチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 62-1. 71 (2H, m), 1. 76-1. 82 (2H, m), 1. 92-1. 98 (1H, m), 2. 04-2. 12 (1H, m), 2. 39 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 02-3. 12 (2H, m), 3. 23 (3H, s), 3. 26-3. 34 (2H, m), 3. 58 (3H, s), 3. 71-3. 76 (2H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 01-4. 07 (1H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 37 (1H, s); 7. 46 (1H, s), 9. 08 (1H, s), 9. 33 (1H, s).

5 MS: m/e (ESI) 614. 3 (MH⁺)

実施例 824

5-{2-第3ブチル-6-(3-エトキシピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミ
ノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキ
シ}-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 09 (3H, t, J=6. 4Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 68-1. 70 (2H, m), 1. 76-1. 84 (2H, m), 1. 88-1. 98 (1H, m), 2. 04-2. 12 (1H, m), 2. 28 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 04-3. 12 (2H, m), 3. 26-3. 47 (3H, m), 3. 78 (2H, q, J=6. 4Hz), 3. 87 (3H, s), 3. 89-3. 90 (2H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 14 (1H, brs), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 9. 07 (1H, brs), 9. 30 (1H, brs).

15

MS: m/e (ESI) 628. 4 (MH⁺)

実施例 825

5-{2-第3ブチル-6-(3-エトキシピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミ
ノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキ
シ}-ペンタン酸 メチルエステル;塩酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 09 (3H, t, J=6. 7Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 68-1. 71 (2H, m), 1. 74-1. 82 (2H, m), 1. 88-1. 98 (1H, m), 2. 04-2. 12 (1H, m), 2. 39 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 03-3. 11 (2H, m), 3. 24-3. 38 (2H, m), 3. 77-3. 80 (2H, m), 3. 58 (3H, s), 3. 86 (3H, s), 3. 88-3. 92 (2H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 11-4. 15 (1H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 9. 09 (1H, s), 9. 37 (1H, s).

25

MS:m/e (ESI) 628. 3 (MH⁺)

実施例 826

5-[2-第3ブチル-6-(3-シアノ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ペンタン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 68-1. 72 (2H, m), 1. 77-1. 85 (2H, m), 2. 18-2. 21 (1H, m), 2. 40 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 08-3. 12 (1H, m), 3. 24-3. 38 (3H, m), 3. 58 (3H, s), 3. 85 (3H, s), 3. 86-3. 92 (3H, m), 3. 94 (3H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 40 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 93 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 609. 3 (MH⁺)

実施例 827

3-[3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジルオキシ]-4-シアノ-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 16 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 31 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 65 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 75-3. 06 (6H, m), 4. 08 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 67 (2H, dd, J=11. 6Hz, 11. 6Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 72 (1H, s), 7. 77 (1H, s), 7. 92 (1H, s), 8. 20 (1H, d, J=4. 4Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 23 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

実施例 828

4-[2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 91 (6H, t, J=6. 8Hz), 1. 21 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 32 (9H, s), 2. 02-2. 13 (2H, m), 2. 48 (2H

, t, J=7.6Hz), 3.04-3.19 (4H, m), 3.91 (3H, s), 3.93 (3H, s), 4.06-4.17 (4H, m), 4.72 (2H, s), 5.65 (2H, s), 6.83 (1H, s), 7.49 (1H, s), 7.59 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 586.3 (MH⁺)

実施例 829

- 5 4-{2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 0.93 (6H, br), 1.17 (3H, br), 1.35 (12H, br), 2.01 (2H, br), 2.42-2.56 (2H, br), 2.76 (3H, br), 3.60-4.48 (6H, m), 4.87 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.48 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.90 (1H, s), 8.53 (1H, br), 9.42 (1H, s), 9.94 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 610.4 (MH⁺)

実施例 830

- 15 2-{2-[3-第3ブチル-5-(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.36 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=6.8Hz), 2.85 (3H, d, J=4.0Hz), 3.02 (3H, s), 3.32 (3H, s), 4.30 (2H, q, J=6.8Hz), 4.89 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.57 (1H, s), 7.79 (1H, s), 7.84 (1H, s), 7.93 (1H, s), 8.23 (1H, q, J=4.0Hz), 8.58 (1H, s), 9.25 (1H, s), 9.89 (1H, s).

実施例 831

- 25 2-{2-[3-第3ブチル-5-(ジメタンスルフォニル-アミノ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.37 (9H, s), 1.44 (3H, t, J=6.4Hz), 2.84 (3H, s), 3.61 (6H, s), 4.30 (2H, q, J=6.4Hz), 4

. 90 (2H, s), 5. 58 (2H, s), 7. 58 (1H, s), 7. 87 (1H, s), 7. 93 (1H, s), 8. 09 (1H, s), 8. 22 (1H, s), 8. 59 (1H, s), 9. 28 (1H, s), 9. 88 (1H, s).

実施例 832

1-(7-第 3 ブチルベンゾオキサゾール-5-イル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 32 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 50 (9H, s), 4. 14 (2H, d, J=7. 2Hz), 4. 24 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 62 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 92 (1H, s), 8. 44 (1H, s), 8. 98 (1H, s), 9. 11 (1H, s), 9. 40 (1H, s).

10 実施例 833

1-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-2,5-ジオン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 27 (9H, s), 2. 74-2. 95 (4H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 35 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 37 (1H, s), 7. 94 (1H, dd, J=8. 0, 2. 0Hz), 8. 10 (1H, d, J=2. 0Hz).

実施例 834

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酪酸; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 10-1. 23 (4H, m), 1. 74-2. 10 (2H, m), 2. 27-2. 35 (1H, m), 2. 43 (1H, t, J=7. 2Hz), 3. 42 (1H, dd, J=7. 2, 6. 0Hz), 3. 90 (1H, ddd, J=7. 2, 5. 6, 1. 6Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 42 (2H, s), 5. 45 (1H, dd, 6. 0, 1. 6Hz), 6. 81 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 66 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 83 (1H, dd, J=8. 4, 2. 0Hz), 7. 93 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 99 (1H, d, J=8. 4Hz).

実施例 835

4-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酪酸;トリフルオロ酢酸塩
1H-NMR (DMSO-d6) δ :

5 1. 36 (9H, s), 1. 75-1. 84 (2H, m), 2. 25-2. 31 (2H, m), 3. 30-3. 40 (2H, m), 3. 86 ((3H, s), 3
. 95 (3H, s), 4. 78 (2H, s), 5. 35 (2H, s), 5. 70-5. 78 (1H, m), 6. 75 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 34 (
1H, s), 7. 70 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 74 (1H, s), 9. 00-9. 07 (1H, m), 9. 28-9. 32 (1H, m).

実施例 836

5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-ペンタン酸;塩酸塩

10

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 61-1. 70 (2H, m), 1. 76-1. 84 (2H, m), 2. 12-2. 22 (1H, m), 2. 28 (2H, t, J=6
. 8Hz), 2. 36-2. 41 (1H, m), 3. 02-3. 10 (1H, m), 3. 25-3. 29 (1H, m), 3. 42-3. 49 (1H, m), 3.
61-3. 70 (1H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 01-4. 08 (2H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 40 (1H, b
rd, J=56Hz), 5. 55 (2H, d, J=4. 4Hz), 7. 36 (1H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 9. 10 (1H, b
r), 9. 45 (1H, br).

15

MS:m/e (ESI) 588. 3 (MH⁺)

実施例 837

5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-ペンタン酸 メチルエステル;塩酸塩

20

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 61-1. 72 (2H, m), 1. 75-1. 84 (2H, m), 2. 08-2. 22 (2H, m), 2. 38 (2H, t, J=6
. 8Hz), 3. 02-3. 10 (1H, m), 3. 25-3. 28 (1H, m), 3. 42-3. 50 (1H, m), 3. 58 (3H, s), 3. 64-3.
68 (1H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 40-4. 42 (2H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 40 (1H, brd, J=
56Hz), 5. 59 (2H, d, J=4. 0Hz), 7. 36 (1H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 9. 12 (1H, brs), 9

25

. 51 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 602. 3 (MH⁺)

実施例 838

- 5 3-{3-第3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジルオキシ}-4-シアノ-酪酸; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 59-3. 11 (8H, m), 4. 29 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 68 (2H, dd, J=12. 0Hz, 12. 0Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 75 (1H, s), 7. 79 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=4. 4Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 23 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

実施例 839

- 15 5-{2-第3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 18 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 66-1. 88 (4H, m), 2. 25-2. 42 (2H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 05 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 14 (2H, t, J=7. 0Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 17 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 83 (1H, s), 7. 90 (1H, d, J=8. 0Hz).

実施例 840

- 20 5-{2-第3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシメチル]-4, 5-ジヒドロ-イソキサゾール-3-カルボン酸; 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 85-1. 90 (4H, m), 3. 06-3. 14 (4H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 92-3. 99 (1H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 06-4. 10 (1H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 16-5. 22 (1H, m), 5. 58 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 40 (1H, s), 7. 48 (1H, s), 9. 11 (1H, s), 9. 51 (1H, s).

実施例 841

5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジシン-1-イル)-フェノキシメチル}-4,5-ジヒドロ-イソキサゾール-3-カルボン酸 メチルエステル;塩酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1.84-1.91 (4H, m), 3.06-3.18 (4H, m), 3.78 (3H, s), 3.86 (3H, s), 3.96-4.00 (1H, m), 3.95 (3H, s), 4.09 (1H, dd, J=7.2, 10.4Hz), 4.79 (2H, s), 5.17-5.26 (1H, m), 5.55 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.48 (1H, d, J=2.0Hz), 9.10 (1H, s), 9.45 (1H, s).

10 実施例 842

6-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ニコチン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.22-1.58 (12H, m), 2.83 (3H, brs), 4.20-4.46 (2H, m), 4.88 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.17-7.48 (2H, m), 7.55 (1H, s), 7.85-7.99 (1H, m), 8.03 (1H, s), 8.15-8.26 (1H, m), 8.29-8.41 (1H, m), 8.57 (1H, s), 8.66 (1H, brs), 9.18-9.27 (1H, m), 9.79-9.97 (2H, m).

実施例 843

6-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ニコチン酸メチルエステル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.34 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.2), 2.83 (3H, d, J=4.4), 3.85 (3H, s), 4.15-4.42 (2H, m), 4.88 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.15-7.35 (2H, m), 7.55 (1H, s), 7.95 (1H, d, J=8.4Hz), 8.04
25 (1H, s), 8.13-8.28 (1H, m), 8.39 (1H, dd, J=8.4 and 2.4Hz), 8.57 (1H, s), 8.69 (1H, brs), 9.17-9.29 (1H, m), 9.80-9.92 (2H, m).

実施例 844

5-[2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ペンタン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

5 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 14-1.18 (4H, m), 1.21-1.25 (2H, m), 1.38 (9H, s), 1.94-2.03 (2H, m), 2.09-2.21 (3H, m), 2.43 (2H, br. t, J=6Hz), 2.71-2.80 (1H, brs), 2.96-3.07 (2H, brs), 3.28-3.37 (2H, brs), 3.69 (3H, s), 3.70 (2H, q, J=7Hz), 4.21-4.26 (2H, brs), 4.88 (2H, s), 6.40 (2H, s), 7.65 (1H, d, J=8Hz), 7.77-7.82 (3H, m).

10 実施例 845

5-[2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ペンタン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

15 1.20 (2H, m), 1.38 (9H, s), 1.84-1.92 (2H, m), 2.06-2.16 (2H, m), 2.44 (2H, br. t, J=6Hz), 2.70-2.79 (2H, 1H, brs), 2.95-3.06 (2H, brs), 3.26-3.37 (2H, brs), 3.69 (3H, s), 3.69 (2H, q, J=7Hz), 3.96 (3H, s), 3.98 (3H, s), 4.20-4.24 (2H, m), 4.85 (2H, s), 6.09 (2H, s), 6.92 (1H, s), 7.76 (2H, s).

実施例 846

20 [2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

25 0.97 (3H, d, J=5.2Hz), 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.48-2.22 (4H, m), 2.70-2.91 (1H, m), 2.82 (3H, d, J=3.2Hz), 3.68-3.80 (1H, m), 3.85 (1H, d, J=15.2Hz), 4.27 (2H, d, J=7.2Hz), 4.83 (2H, s), 5.03 (1H, d, J=15.2Hz), 5.44 (1H, d, J=18.8Hz), 5.52 (1H, d,

J=18.8Hz), 7.43 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.12-8.30 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.14 (1H, brs), 9.83 (1H, brs).

実施例 847

5 [2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチルピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸エチルエステル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

0.97 (3H, d, J=5.6Hz), 1.22 (3H, t, J=7.2Hz), 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.46-1.58 (1H, m), 1.65-1.80 (1H, m), 1.81-1.94 (1H, m), 2.08-2.22 (1H, m), 2.68-2.80 (1H, m), 2.82 (3H, d, J=4.0Hz), 3.40-3.58 (1H, m), 3.65-3.79 (1H, m), 4.00 (1H, d, J=15.6Hz), 4.10-4.35 (4H, m), 4.84 (2H, s), 5.07 (1H, d, J=15.6Hz), 5.45 (1H, d, J=19.2Hz), 5.53 (1H, d, J=19.2Hz), 7.45 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.20 (1H, brs), 8.55 (1H, s), 9.15 (1H, brs), 9.84 (1H, brs).

実施例 848

15 2-{2-[3-(アセチル-メチル-アミノ)-5-第3ブチル-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1.34 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 1.81 (3H, brs), 2.83 (3H, d, J=4.8Hz), 3.29 (3H, s), 4.29 (2H, q, J=7.2Hz), 4.87 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.55 (1H, s), 7.65-7.98 (3H, m), 8.12-8.27 (1H, m), 8.57 (1H, s), 9.22 (1H, brs), 9.87 (1H, brs).

実施例 849

25 6-[2-(8-第3ブチル-4-メタンスルフォニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 28-1.46 (12H, m), 1.81 (3H, brs), 2.77 (3H, d, J=3.6Hz), 3.18 (3H, s), 3.86 (2H, brs),
 , 4.24 (2H, q, J=6.8Hz), 4.45 (2H, brs), 4.88 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.66 (1H, s), 7.99 (1
 H, s), 8.14 (1H, s), 8.43-8.61 (1H, m), 9.34-9.48 (1H, m), 9.87-10.01 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 544.2 (MH⁺)

5 実施例 850

5-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
 ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェノキシ}-ペンタン
 酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1.18 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 1.68-1.82 (4H, m), 2.39 (2H
 , t, J=6.8Hz), 2.83 (3H, d, J=4.0Hz), 2.94-3.02 (4H, m), 3.76-3.83 (4H, m), 4.04 (2H, q
 , J=7.0Hz), 4.24 (2H, t, J=6.8Hz), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.83 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.
 51 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.63 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.0Hz), 8.57 (1H, s), 9.19 (1H, brs
), 9.86 (1H, brs).

15 実施例 851

5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
 ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェノキシ}-ペンタン酸 エ
 チルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.17 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.70-1.84 (4H, m), 2.37-2.44 (2H, m), 2.96-3.03 (4
 H, m), 3.75-3.92 (4H, m), 3.97 (3H, s), 3.96 (3H, s), 4.04 (2H, q, J=6.8Hz), 4.24 (2H, t
 , J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.37 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.62 (1H, s).

実施例 852

(1-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
 ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-
 イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 99-2. 12 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=3. 6Hz), 3. 06-3. 16 (2H, m), 3. 64 (3H, s), 4. 05 (2H, s), 4. 16-4. 35 (3H, m), 4. 83 (2H, s), 5. 48 (2H, brs), 7. 35 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 13-8. 24 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 10-9. 18 (1H, m), 9. 79-9. 89 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 581. 3 (MH⁺)

実施例 853

(1-{3-第 3 プチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 24-1. 54 (12H, m), 1. 98-2. 14 (2H, m), 2. 77 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 06-3. 15 (2H, m), 3. 64 (3H, s), 4. 05 (2H, s), 4. 13-4. 42 (2H, m), 4. 87 (2H, s), 5. 53 (2H, brs), 7. 34 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 42-8. 62 (1H, m), 9. 32-9. 45 (1H, m), 9. 90-10. 00 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 582. 3 (MH⁺)

実施例 854

(1-{3-第 3 プチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 98-2. 13 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 06-3. 15 (2H, m), 3. 38-3. 48 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 64 (3H, s), 4. 17 (2H, s), 4. 18-4. 40 (3H, m), 4. 84 (2H, s), 5. 40-5. 56 (2H, m), 7. 34 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 44 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, s), 8. 11-8. 28 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 12-9. 18 (1H, m), 9. 79-9. 86 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 595. 3 (MH⁺)

実施例 855

メチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバ
モイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;

臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 35 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 70 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28
(2H, q, J=6. 8Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 26 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 86-
7. 93 (3H, m), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 20 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 481. 1 (MH⁺)

実施例 856

- 10 メチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水
素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 35 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 70 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 11
(2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 25 (1H, d, J=8. 8
Hz), 7. 33 (1H, s), 7. 88-7. 92 (3H, m).

MS:m/e (ESI) 486. 2 (MH⁺)

実施例 857

- 20 メチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバ
モイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エ
ステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 35 (9H, s), 1. 36 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 70 (3H, d, J=4. 6Hz), 2. 78 (3H, d, J=4. 6Hz), 4. 24
(2H, q, J=7. 0Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 26 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 87-7. 94 (3H, m),
8. 00 (1H, s), 8. 53 (1H, q, J=4. 6Hz), 9. 43 (1H, brs), 9. 96 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 482. 1 (MH⁺)

実施例 858

{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=6.8Hz), 1.32 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 2.56 (1H, dd, J=16.8, 8.2Hz), 2.77 (1H, dd, J=16.8, 4.0Hz), 2.92 (3H, s), 3.08 (1H, dd, J=16.4, 8.0Hz), 3.62-3.72 (1H, m), 4.12 (2H, q, J=6.8Hz), 7.22 (2H, d, J=6.8Hz), 4.58-4.64 (1H, m), 4.78 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.18 (1H, s), 7.24 (1H, s).

10 実施例 859

{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.34 (9H, s), 2.54 (1H, dd, J=16.8, 8.2Hz), 2.74 (1H, dd, J=16.8, 4.4Hz), 2.94 (3H, s), 3.08 (1H, dd, J=16.4, 8.0Hz), 3.60-3.72 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.97 (3H, s), 4.57-4.64 (1H, m), 4.80 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.18 (1H, s), 7.27 (1H, s), 7.36 (1H, s).

実施例 860

{8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.29 (9H, s), 1.36 (3H, t, J=7.0Hz), 2.50-2.62 (1H, m), 2.75-2.82 (1H, m), 2.78 (3H, d, J=4.0Hz), 2.92 (3H, s), 3.04-3.12 (1H, m), 3.62-3.74 (1H, m), 4.24 (2H, q, J=7.0Hz), 4.58-4.64 (1H, m), 4.88 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.19 (1H, s), 7.30 (1H, s), 7.98 (1H, s), 8.56 (1H, q, J=4.0Hz), 9.94 (1H, brs).

25

実施例 861

{8-第3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサ
ジン-2-イル}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 20 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 29 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 30 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 62
(1H, dd, J=16.0, 8.8Hz), 2. 88 (1H, dd, J=16, 3.6Hz), 2. 90 (3H, s), 3. 08 (1H, dd, J=12, 8
. 0Hz), 3. 38 (1H, dd, J=12, 3.6Hz), 4. 08 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 10 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 21 (
2H, q, J=6.8Hz), 4. 60-4. 66 (1H, m), 4. 78 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 19 (1H, s), 7. 28 (1H, s
) , 7. 34 (1H, s), 9. 03 (1H, brs), 9. 36 (1H, brs).

10

実施例 862

{8-第3 ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサ
ジン-2-イル}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 20 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 30 (9H, t), 2. 62 (1H, dd, J=16, 9.2Hz), 2. 86 (1H, dd, J=16, 3.2
Hz), 2. 90 (3H, s), 3. 08 (1H, dd, J=12, 8.0Hz), 3. 40 (1H, dd, J=12, 2.4Hz), 3. 86 (3H, s),
3. 95 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 60-4. 68 (1H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 18
(1H, d, J=2.0Hz), 7. 28 (1H, d, J=2.0Hz), 7. 35 (1H, s), 9. 04 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

20 実施例 863

{8-第3 ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒド
ロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベン
ゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 20 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 29 (9H, s), 1. 37 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 62 (1H, dd, J=19.2, 8.8Hz
) , 2. 77 (3H, d, J=4.0Hz), 2. 86 (1H, dd, J=19.2, 3.2Hz), 2. 91 (3H, s), 3. 09 (1H, dd, J=12

, 8. 8Hz), 3. 40 (1H, dd, J=12, 3. 6Hz), 4. 09 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 23 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 57-4. 70 (1H, m), 4. 87 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 20 (1H, s), 7. 29 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 55 (1H, q, J=4. 0Hz), 9. 51 (1H, brs), 9. 96 (1H, brs).

実施例 864

- 5 2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピロリジン-3-イル
オキシ)-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 92 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 44 (9H, s), 1. 61-1. 83 (2H, m), 2. 10-2. 24 (2H, m), 3. 09-3. 17 (1H, m), 3. 19-3. 26 (1H, m), 3. 41-3. 56 (2H, m), 3. 74 (3H, s), 3. 92 (1H, dd, J=7. 6 and 4. 8 Hz), 3. 94 (3H, s), 4. 02 (3H, s), 4. 25-4. 33 (1H, m), 4. 85 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 24 (1H, s), 7. 46 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 60 (1H, d, J=2. 0Hz).

実施例 865

- 15 2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピロリジン-3-イル
オキシ)-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 00 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 44 (9H, s), 1. 63-1. 87 (2H, m), 2. 04-2. 19 (2H, m), 3. 13-3. 22 (1H, m), 3. 22-3. 30 (1H, m), 3. 40-3. 57 (2H, m), 3. 74 (3H, s), 3. 94 (3H, s), 3. 98 (1H, dd, J=7. 6 and 4. 4Hz), 4. 02 (3H, s), 4. 25-4. 35 (1H, m), 4. 86 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 24 (1H, s), 7. 46 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 60 (1H, d, J=2. 0Hz).

実施例 866

- 25 8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサ
ジン-2-カルボン酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 17 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 28 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 39 (9H, s), 1. 27-1. 44 (3H, m), 2. 91 (3H, s), 3. 42-3. 55 (2H, m), 4. 12 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 10-4. 20 (2H, m), 4. 22 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 28-5. 32 (1H, m), 5. 47 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 32-7. 36 (2H, m), 9. 03 (1H, brs), 9. 34 (1H, brs).

5 実施例 867

2-(3,5-ジ第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-ベンゾイルアミノ)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩
1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 41 (21H, m), 2. 82 (3H, d, J=4.8Hz), 4. 27 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 99 (2H, s), 7. 47 (1H, s), 7. 77 (2H, s), 8. 20 (1H, q, 4.8Hz), 8. 52 (1H, s).

10

MS:m/e (ESI) 481. 2 (MH⁺)

実施例 868

1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 75 (6H, s), 3. 82 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 45 (1H, d, J=2.0Hz), 7. 53 (1H, d, J=2.0Hz), 9. 06 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

20 実施例 869

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 75 (6H, s), 2. 77 (3H, d, J=4.0Hz), 2. 92 (6H, s), 3. 82 (3H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 45 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 36 (1H, q, J=4.0H

25

z), 8.93 (1H, brs), 9.49 (1H, brs).

実施例 870

6-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン

5 酸メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 2.76 (6H, s), 2.77 (3H, d, J=4.0Hz), 3.83 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=6.8Hz), 4.85 (2H, s), 5.60 (2H, s), 7.48 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.00 (1H, s), 8.57 (1H, q, J=4.0Hz), 9.56 (1H, brs), 9.97 (1H, brs).

10 実施例 871

{8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-3-オキシ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサ
ジン-2-イル}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.35 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.81 (1H, dd, J=16.8, 8.0Hz), 3.05 (1H, dd, J=16.8, 4.0Hz), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 4.98 (1H, d, J=4.0Hz), 5.45 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.41 (1H, d, J=2.0Hz), 7.53 (1H, d, J=2.0Hz), 9.03 (1H, brs), 10.97 (1H, brs).

実施例 872

20 {8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-3-オキシ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサ
ジン-2-イル}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.17 (3H, t, J=7.2Hz), 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.33 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 2.92 (1H, dd, J=16Hz, 8.0Hz), 3.14 (1H, dd, J=16Hz, 4.0Hz), 4.04-4.17 (4H, m), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.04 (1H, dd, J=8.0Hz, 4.0Hz), 5.44 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.41

(1H, s), 7.52 (1H, s), 9.05 (1H, brs), 9.32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 570.2 (MH⁺)

実施例 873

5 2-(1-(3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル)-ピロリジン-3-イル
オキシ)-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.83 and 0.87 [3H(1:1). each t. each

10 J=7.2Hz], 1.10-1.28 (3H, m), 1.38 (9H, s), 1.49-1.75 (2H, m), 1.92-2.17 (2H, m), 2.99
-3.20 (2H, m), 3.25-3.52 (2H, m), 3.64 (3H, s), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.02-4.29 (3
H, m), 4.81 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.37 (1H, s), 7.44 (1H, s), 9.02-9.13 (1H
, m), 9.26-9.39 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 614.3 (MH⁺)

実施例 874

15 1-(3-第3ブチル-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.33 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21
(2H, q, J=6.8Hz), 4.82 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.55 (1H, t, J=8.0Hz), 7.78 (
1H, d, J=8.0Hz), 7.83 (1H, d, J=8.0Hz), 7.97 (1H, s), 9.05 (1H, brs), 9.35 (1H, brs).

実施例 875

25 2-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシフェニル)-2-オキシエチル]-6-ジ
メチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチル
アミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.77 (3H, d, J=4.4Hz), 2.92 (6H, s), 3.89 (3H, s), 4

. 13 (2H, q, J=6.8Hz), 4.74 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.51 (2H, d, J=7.6Hz), 8.07 (1H, s), 8.35-8.38 (1H, m), 8.94 (1H, brs), 9.54 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 481.2 (MH⁺)

実施例 876

5 2-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;

臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 1.39-1.43 (6H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.89 (3H, s), 4.13 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.85 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.51-7.54 (3H, m), 8.21 (1H, q, J=4.8Hz), 8.56 (1H, s), 9.20 (1H, brs), 9.85 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 482.2 (MH⁺)

実施例 877

15 1-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 1.38-1.43 (6H, m), 3.89 (3H, s), 4.08-4.24 (6H, m), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.51 (2H, d, J=5.2Hz), 9.03 (1H, brs), 9.26 (1H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 487.2 (MH⁺)

実施例 878

6-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 1.40-1.43 (6H, m), 2.78 (3H, d, J=4.8Hz), 3.90 (3H, s), 4.13 (2H, q, J=7.0

Hz), 4.24 (2H, q, J=7.0Hz), 4.89 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.50-7.52 (2H, m), 8.00 (1H, s), 8.53 (1H, m), 9.42 (1H, brs), 9.96 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 483.1 (MH⁺)

実施例 879

- 5 (1-(3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル)-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 1.62-1.77 (2H, m), 1.96-2.10 (2H, m), 2.68-2.90 (5H, m), 3.12-3.59 (3H, m), 3.94 (3H, s), 4.08 (2H, s), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz), 4.83 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.51 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.58 (1H, s), 8.14-8.27 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.09-9.17 (1H, m), 9.78-9.88 (1H, m).

実施例 880

- 15 (1-(3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル)-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.36 (9H, s), 1.63-1.76 (2H, m), 1.97-2.08 (2H, m), 2.69-2.82 (2H, m), 3.16-3.60 (3H, m), 3.87 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.07 (2H, s), 4.80 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.57 (1H, s), 9.06-9.10 (1H, m), 9.24-9.32 (1H, m).

実施例 881

- 25 (1-(3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル)-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.19 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.64-1.78 (2H, m), 1.97-2.

10 (2H, m), 2.69-2.80 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8 Hz), 3.18-3.30 (2H, m), 3.49-3.60 (1H, m), 3.93 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.2 Hz), 4.16 (2H, s), 4.28 (2H, q, J=7.2 Hz), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.52 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.58 (1H, s), 8.14-8.30 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.09-9.22 (1H, m), 9.77-9.91 (1H, m).

5 MS: m/e (ESI) 623.2 (MH⁺)

実施例 882

1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジニ-4-イルオキシ}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.19 (3H, t, J=7.2 Hz), 1.36 (9H, s), 1.62-1.78 (2H, m), 1.97-2.10 (2H, m), 2.69-2.84 (2H, m), 3.17-3.32 (2H, m), 3.50-3.58 (1H, m), 3.87 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.2 Hz), 4.17 (2H, s), 4.80 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.37 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.57 (1H, s), 9.06-9.12 (1H, m), 9.24-9.35 (1H, m).

15 MS: m/e (ESI) 600.2 (MH⁺)

実施例 883

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.38-1.41 (12H, m), 3.68 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.81 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.70 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.95-8.10 (2H, m), 9.02 (1H, brs), 9.31 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 507.1 (MH⁺)

25 実施例 884

1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ

インドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェノキシ)-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 37 (9H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 89 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 34 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 7. 70 (1H, s), 9. 10 (1H, brs), 9. 37 (1H, brs).

実施例 885

4-[3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェノキシ]-ブチロニトリル;臭化水素酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 07-2. 16 (2H, m), 2. 67-2. 75 (2H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 90 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 11-4. 18 (2H, m), 4. 82 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 49-7. 59 (2H, m), 9. 00-9. 17 (1H, brs), 9. 27-9. 40 (1H, m).

実施例 886

- 15 2-[2-(3-第 3 ブチル-5-シアノメトキシ-4-メトキシフェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 37 (9H, s), 2. 73-2. 82 (3H, m), 2. 91 (6H, s), 3. 89 (3H, s), 4. 78 (2H, s), 5. 33 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 65 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 31-8. 46 (1H, m), 8. 97 (1H, brs), 9. 55 (1H, brs).

実施例 887

- 25 2-[2-[3-第 3 ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-メトキシフェニル]-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36(9H, s), 2. 06-2. 17(2H, m), 2. 71(2H, t, J=7. 6Hz), 2. 77(3H, d, J=4. 8Hz), 2. 91(6H, s), 3. 89(3H, s), 4. 24(2H, t, J=6. 0Hz), 4. 74(2H, s), 5. 45(2H, s), 7. 15(1H, s), 7. 53(1H, s), 7. 55(1H, s), 8. 07(1H, s), 8. 33-8. 41(1H, m), 8. 95(1H, brs), 9. 55(1H, brs).

実施例 888

5 2-[2-(8-第 3 ブチル-4-シアノメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 36-1. 43(12H, m), 2. 82(3H, d, J=5Hz), 3. 30-3. 40(2H, m), 4. 28(2H, q, J=7Hz), 4. 40(2H, m), 4. 66(2H, s), 4. 85(2H, s), 5. 45(2H, s), 7. 42-7. 45(2H, m), 7. 53(1H, s), 8. 21(1H, q, J=5Hz), 8. 56(1H, s), 9. 22(1H, brs), 9. 82(1H, brs).

MS:m/e (ESI) 504. 3 (MH⁺)

実施例 889

15 6-[2-(8-第 3 ブチル-4-シアノメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 33-1. 38(12H, s), 2. 78(3H, d, J=5Hz), 3. 30-3. 40(2H, m), 4. 25(2H, q, J=7Hz), 4. 40(2H, m), 4. 66(2H, s), 4. 89(2H, s), 5. 49(2H, s), 7. 40-7. 43(2H, m), 7. 99(1H, s), 8. 53(1H, q, J=5Hz), 9. 46(1H, brs), 9. 93(1H, brs).

MS:m/e (ESI) 505. 3 (MH⁺)

実施例 890

25 [8-第 3 ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン-4-イル]-アセトニトリル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 3. 30-3. 40 (2H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 40 (2H, m), 4. 66 (2H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 40-7. 42 (2H, m), 9. 06 (1H, brs), 9. 35 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 481. 3 (MH⁺)

5 実施例 891

{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル]-
アセトニトリル;トリフルオロ酢酸塩}

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 29 (3H, t, J=7Hz), 1. 33-1. 42 (12H, m), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 11 (2H, q, J=7Hz), 4. 21 (2H, q, J=7Hz), 4. 40 (2H, m), 4. 66 (2H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 40-7. 42 (2H, m), 9. 03 (1H, brs), 9. 34 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 509. 3 (MH⁺)

実施例 892

15 {8-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]
ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル)-ア
セトニトリル;トリフルオロ酢酸塩}

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 06-1. 11 (4H, m), 1. 36 (9H, s), 2. 32 (1H, m), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 40 (2H, m), 4. 66 (2H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 41-7. 44 (2H, m), 7. 72 (1H, d, J=8Hz), 8. 09 (1H, d, J=8 Hz), 9. 52, (1H, brs), 9. 64 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 444. 3 (MH⁺)

実施例 893

25 2-[2-(8-第3ブチル-4-シアノメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン
-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イン
インドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩}

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 40 (2H, m), 4. 66 (2H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 41-7. 43 (2H, m), 8. 07 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=4Hz), 8. 98 (1H, brs), 9. 53 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 503. 4 (MH⁺)

実施例 894

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-シアノメトキシ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 89 (3H, s), 4. 29 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 34 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 65 (1H, s), 7. 71 (1H, s), 8. 15-8. 30 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 14-9. 26 (1H, m), 9. 77-9. 93 (1H, m).

実施例 895

15 2-[2-(3-第 3 ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 06-2. 17 (2H, m), 2. 72 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 90 (3H, s), 4. 15 (2H, t, J=6. 0Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 49-7. 62 (3H, m), 8. 15-8. 26 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 18 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

実施例 896

25 2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシベンゾイルアミノ)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34 (9H, s), 1. 41 (3H, t, 6. 8Hz), 2. 74 (6H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 80 (3H, s), 4. 26 (2H, q, J=6. 8Hz), 5. 00 (2H, s), 7. 5-7. 6 (3H, m), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz) 8. 60 (1H, s), 9. 75 (1H, s), 10. 30 (1H, s), 11. 53 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 482. 1 (MH⁺)

実施例 897

{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 37 (9H, s), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 79 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 31-7. 35 (2H, m), 7. 88 (1Hs), 7. 97-7. 99 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 440. 1 (MH⁺)

実施例 898

{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]
ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 08-1. 11 (4H, m), 1. 37 (9H, s), 2. 30-2. 34 (1H, m), 4. 83 (2H, s), 5. 42 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 33 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 72 (1H, d, J=8. 2Hz), 7. 89 (1H, s), 8. 00 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 2Hz), 9. 60 (2H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 403. 0 (MH⁺)

実施例 899

2-[2-(3-第3ブチル-4-シアノメトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ
3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化
水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86

(2H, s), 5.41 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.33 (1H, d, J=8.6Hz), 7.54 (1H, s), 7.89 (1H, s), 8.00 (1H, d, J=8.6Hz), 8.21 (1H, m), 8.56 (1H, s), 9.19 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 463.1 (MH⁺)

実施例 900

- 5 1-(3-第 3 ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.0Hz), 3.87 (3H, s), 3.89 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.13 (2H, q, J=7.0Hz), 4.81 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.51 (1H, s), 9.03 (1H, brs), 9.30 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 459.1 (MH⁺)

実施例 901

- 15 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-シアノメトキシ-5-エトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.38 (9H, s), 1.45 (3H, t, J=7.2Hz), 2.78 (3H, d, J=4.6Hz), 2.92 (6H, s), 4.19 (2H, q, J=7.2Hz), 4.74 (2H, s), 5.19 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.55 (2H, s), 8.07 (1H, s), 8.36 (1H, q, J=4.6Hz), 8.95 (1H, brs), 9.53 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 506.2 (MH⁺)

実施例 902

- 25 {2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 45 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 19 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 19 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 54 (2H, d, J=1. 2Hz), 9. 08 (1H, br s), 9. 33 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 484. 1 (MH⁺)

5 実施例 903

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-シアノメトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 37 (9H, s), 2. 78 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 92 (6H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 33 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 89 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 95 (1H, brs), 9. 53 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 462. 1 (MH⁺)

実施例 904

15 {2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 4. 12 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 33 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 88 (1H, s), 7. 98 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 02 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 468. 1 (MH⁺)

実施例 905

{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 67 (3H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 33 (1H, d, J=8. 4Hz)

), 7.71 (1H, d, J=8.4Hz), 7.89 (1H, d, J=2.0Hz), 8.00 (1H, dd, J=2.0, 8.4Hz), 8.16 (1H, d, J=8.4Hz), 9.50 (1H, brs), 9.97 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 377.0 (MH⁺)

実施例 906

5 〔2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ]-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.31 (3H, t, J=7.6Hz), 1.37 (9H, s), 2.95 (2H, q, J=7.6Hz), 4.87 (2H, s), 5.41 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.33 (1H, d, J=8.8Hz), 7.74 (1H, d, J=8.0Hz), 7.90 (1H, s), 8.01 (1H, d, J=8.4Hz), 8.18 (1H, d, J=8.0Hz), 9.52 (1H, brs), 9.87 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 391.0 (MH⁺)

実施例 907

15 2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.82 (3H, d, J=4.0Hz), 2.94-3.04 (4H, m), 3.70-3.86 (4H, m), 3.95 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.50 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.61 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.0Hz), 8.56 (1H, s), 9.16 (1H, brs), 9.84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 524.2 (MH⁺)

実施例 908

25 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 95-3. 05 (4H, m), 3. 74-3. 85 (4H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 3. 96 (3H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 60 (1H, s).

実施例 909

5 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノフェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 08-1. 15 (4H, m), 1. 37 (9H, s), 2. 28-2. 36 (1H, m), 2. 94-3. 06 (4H, m), 3. 75-3. 86 (4H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 50 (1H, s), 7. 61 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 10 (1H, d, J=8. 0Hz).

実施例 910

15 {3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インドル-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 89 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 33 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 9. 00-9. 10 (1H, m), 9. 29-9. 37 (1H, m).

実施例 911

20 4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インドル-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチロニトリル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

25 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 07-2. 17 (2H, m), 2. 72 (2H, t, J=7. 2Hz), 3. 90 (3H, s), 4. 07-4. 17 (4H, m), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 96-9. 09 (1H, m), 9. 23-9. 36 (1H, m)

実施例 912

[3-第3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水

5 素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.05-1.16 (4H, m), 1.37 (9H, s), 2.27-2.37 (1H, m), 3.89 (3H, s), 4.84 (2H, s), 5.33 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.65 (1H, s), 7.70 (1H, s), 7.72 (1H, d, J=8.0Hz), 8.10 (1H, d, J=8.0Hz), 9.51 (1H, brs), 9.67 (1H, brs).

10 実施例 913

4-[3-第3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ]-ブチロニトリル;

臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.05-1.18 (4H, m), 1.36 (9H, s), 2.07-2.18 (2H, m), 2.28-2.38 (1H, m), 2.72 (2H, t, J=7.2Hz), 3.89 (3H, s), 4.15 (2H, t, J=6.0Hz), 4.83 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.55 (2H, brs), 7.72 (1H, d, J=8.0Hz), 8.10 (1H, d, J=8.0Hz), 9.04-9.55 (2H, m).

実施例 914

1-(3-第3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素

20 酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.03-1.17 (4H, m), 1.33 (6H, d, J=6.0Hz), 1.35 (9H, s), 2.25-2.37 (1H, m), 3.88 (3H, s), 4.65-4.79 (1H, m), 4.82 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.51 (2H, s), 7.72 (1H, d, J=8.0Hz), 8.10 (1H, d, J=8.0Hz), 9.46-9.73 (2H, m).

実施例 915

1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 29 (3H, t, J=7.2 Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=7.2 Hz), 2. 74 (6H, s), 3. 82 (3H, s), 4. 14 (2H, q, J=7.2 Hz), 4. 21 (2H, q, J=7.2 Hz), 4. 77 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 32 (1H, s), 7. 45 (1H, d, J=2.0 Hz), 7. 53 (1H, d, J=2.0 Hz) .

MS:m/e (ESI) 486. 2 (MH⁺)

実施例 916

- 10 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 29 (3H, t, J=6.8 Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6.8 Hz), 2. 95-3. 12 (4H, m), 3. 75-3. 84 (4H, m), 3. 94 (3H, s), 4. 12 (2H, q, J=6.8 Hz), 4. 20 (2H, q, J=6.8 Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 59 (1H, s) .

MS:m/e (ESI) 528. 2 (MH⁺)

実施例 917

- 20 メタンсульфон酸 2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 40-1. 43 (12H, m), 2. 82 (3H, d, J=4.8 Hz), 3. 68 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6.8 Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 70 (1H, d, J=8.4 Hz), 7. 97-8. 00 (2H, m), 8. 19-8. 22 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 20 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs) .

MS:m/e (ESI) 502. 1 (MH⁺)

実施例 918

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 40 (9H, s), 2. 77 (3H, d, $J=4.8\text{Hz}$), 2. 92 (6H, s), 3. 68 (3H, s), 4. 76 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 70 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7. 95-8. 00 (2H, m), 8. 07 (1H, s), 8. 34-8. 37 (1H, m), 8. 96 (1H, brs), 9. 57 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 501. 1 (MH^+)

10 実施例 919

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1. 36 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 41 (9H, s), 2. 77 (3H, d, $J=4.4\text{Hz}$), 3. 68 (3H, s), 4. 24 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 90 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 70 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7. 95-8. 00 (3H, m), 8. 52 (1H, m), 9. 44 (1H, brs), 9. 99 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 503. 1 (MH^+)

実施例 920

20 2-{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロパン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1. 15 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1. 33-1. 48 (12H, m), 3. 30-3. 40 (2H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 10. (2H, m), 4. 40 (2H, m), 4. 71 (1H, q, $J=6\text{Hz}$), 4. 79 (2H, s), 5. 40 (1H, d, $J=18\text{Hz}$), 5. 50 (1H, d, $J=18\text{Hz}$), 7. 18 (1H, brs), 7. 27 (1H, brs), 7. 35 (1H, s), 9. 06 (1H, brs), 9. 38 (1H

, brs).

実施例 921

2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-
イル}-プロパン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.03-1.12 (4H, m), 1.15 (3H, t, J=7Hz), 1.35 (9H, s), 1.44 (3H, d, J=6Hz), 2.32 (1H, m),
3.30-3.40 (2H, m), 4.09 (2H, m), 4.25-4.30 (2H, m), 4.28 (2H, m), 4.71 (1H, q, J=6Hz), 4.
.80 (2H, s), 5.43 (1H, d, J=18Hz), 5.52 (1H, d, J=18Hz), 7.20 (1H, s), 7.28 (1H, s), 7.71
(1H, d, J=8Hz), 8.08 (1H, d, J=8Hz), 9.50 (1H, brs), 9.62 (1H, brs).

実施例 922

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-シアノメトキシ-5-ジメチルアミノ-フェニル)-2-オキシ-
エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル
ボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.39 (9H, s), 2.71 (6H, s), 2.77 (3H, d, J=4.4Hz), 2.91 (6H, s), 4.74 (2H, s), 5.25 (2H, s)
, 5.46 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.60 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.35 (1H, m), 8.92
(1H, brs), 9.53 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 505.2 (MH⁺)

実施例 923

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-オキシ-
エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.91 (4H, brs), 2.82 (3H, d, J=4.0Hz), 3.15 (4H, br
s), 3.64 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=7.0Hz), 4.83 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.43 (1

H, s), 7.53 (1H, s), 8.18-8.21 (1H, m), 8.55 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 507.2 (MH⁺)

実施例 924

5 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.91 (4H, brs), 3.15 (4H, brs), 3.64 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.78 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.34 (1H, s), 7.42 (1H, s), 9.01 (1H, brs), 9.23 (1H, brs).

10

MS: m/e (ESI) 512.2 (MH⁺)

実施例 925

15 2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-オキソエチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.91 (4H, brs), 2.78 (3H, d, J=4.4Hz), 2.91 (6H, s), 3.15 (4H, brs), 3.64 (3H, s), 4.72 (2H, s), 5.42 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.35 (1H, s), 7.43 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.35-8.38 (1H, m).

20

MS: m/e (ESI) 506.3 (MH⁺)

実施例 926

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

25

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.08-1.11 (4H, m), 1.38 (9H, s), 1.91 (4H, brs), 2.29-2.35 (1H, m), 3.15 (4H, brs), 3.6

5 (3H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 6Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 6Hz), 9. 50 (1H, brs), 9. 62 (1H, brs).

実施例 927

5 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 91 (4H, brs), 3. 15 (4H, brs), 3. 65 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 43 (1H, s), 9. 02 (1H, brs), 9. 23 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 484. 2 (MH⁺)

実施例 928

15 2-[2-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (6H, d, J=6. 4Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 88 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 64-4. 77 (1H, m), 4. 85 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 51 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 14-8. 26 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 12-9. 21 (1H, m), 9. 79-9. 89 (1H, m).

実施例 929

25 1-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 33 (6H, d, J=6. 0Hz), 1. 35 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 88

(3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.64-4.77 (1H, m), 4.80 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.50 (2H, s), 9.05 (1H, brs), 9.29 (1H, brs).

実施例 930

5 1-(3-第3ブチル-5-インプロボキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イ
ミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水
素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.33 (6H, d, J=5.6Hz), 1.35 (9H, s), 3.87 (3H, s), 3.88 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.64-4.76
 (1H, m), 4.81 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.50 (2H, s), 8.99-9.16 (1H, m), 9.25-
 10 9.40 (1H, m).

実施例 931

2-{8-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン
-4-イル}-プロパン酸 エチルエステル;塩酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.15 (3H, t, J=7Hz), 1.30-1.50 (15H, m), 2.82 (3H, d, J=5Hz), 3.30-3.40 (2H, m), 4.09 (2H, m),
 4.22-4.36 (4H, m), 4.71 (1H, q, J=6Hz), 4.82 (2H, s), 5.38 (1H, d, J=18Hz), 5.48 (1H, d, J=18Hz),
 7.20 (1H, brs), 7.28 (1H, brs), 7.53 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=5Hz), 8.55 (1H, s), 9.21 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

20 実施例 932

2-{8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒ
ドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オ
キサジン-4-イル}-プロパン酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.15 (3H, t, J=7Hz), 1.32-1.39 (12H, m), 1.44 (3H, d, J=7Hz), 2.33 (1H, m), 2.77 (3H, d, J=5Hz),
 3.30-3.40 (2H, m), 4.09 (2H, m), 4.20-4.30 (4H, m), 4.71 (1H, q, J=7Hz), 4.86 (

2H, s), 4.82 (2H, s), 5.43 (1H, d, J=18Hz), 5.52 (1H, d, J=18Hz), 7.20 (1H, d, J=2Hz), 7.27 (1H, d, J=2Hz), 7.98 (1H, s), 8.55 (1H, q, J=5Hz), 9.47 (1H, brs), 9.92 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 566.2 (MH⁺)

実施例 933

- 5 2-(8-第 3 ブチル-6-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル)-プロパン酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.15 (3H, t, J=7Hz), 1.32-1.39 (9H, m), 1.44 (3H, d, J=7Hz), 2.77 (3H, d, J=5Hz), 3.30-3.40 (2H, m), 4.10 (2H, m), 4.27 (2H, m), 4.70-4.73 (3H, m), 5.35 (1H, d, J=18Hz), 5.46 (1H, d, J=18Hz), 7.14 (1H, s), 7.21 (1H, d, J=2Hz), 7.27 (1H, d, J=2Hz), 8.08 (1H, s), 8.37 (1H, q, J=5Hz), 9.06 (1H, brs), 9.57 (1H, brs).

実施例 934

- 15 2-[2-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.20 (6H, d, J=7.2Hz), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.78 (6H, s), 2.81 (3H, d, J=4.4Hz), 3.77 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.4Hz), 8.56 (1H, s), 9.17 (1H, brs), 9.84 (1H, brs).

実施例 935

- 25 2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.20 (6H, d, J=6.8Hz), 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.78 (6H, s), 3.76

(3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 22 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34-7. 36 (2H, m), 7. 52 (1H, s).

実施例 936

5 2-[2-(3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-メチルアミノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 76 (3H, d, J=5. 0Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 72 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 5. 51 (1H, q, J=5. 0Hz), 7. 05 (1H, s), 7. 24 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 17 (1H, brs), 9. 82 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 467. 3 (MH⁺)

実施例 937

15 6-[2-(3-第 3 プチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 26-1. 43 (18H, m), 2. 77 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 88 (3H, s), 4. 24 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 64-4. 77 (1H, m), 4. 88 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 50 (2H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 47-8. 58 (1H, m), 9. 34-9. 46 (1H, m), 9. 90-10. 03 (1H, m).

実施例 938

25 2-[2-(3-第 3 プチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (6H, d, J=6. 0Hz), 1. 35 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 88 (3H, s), 4

. 63-4. 80 (3H, m), 5. 44 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 50 (2H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 31-8. 43 (1H, m), 8. 88-8. 99 (1H, m), 9. 46-9. 60 (1H, m).

実施例 939

5 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-インソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 88-2. 13 (4H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 86-2. 98 (2H, m), 3. 02-3. 18 (3H, m), 3. 93 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 52 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 61 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 14-8. 26 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 10-9. 18 (1H, m), 9. 81-9. 88 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 546. 2 (MH⁺)

実施例 940

15 1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-インソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 6. 95 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 32 (1H, s), 7. 75 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 80 (1H, s), 9. 00 (1H, brs), 9. 30 (1H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 429. 1 (MH⁺)

実施例 941

25 2-{8-第 3 ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-インソインドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン-4-イル}-2-メチル-プロパン酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 38 (3H, t, J=7Hz), 1. 48 (6H, s), 2. 82 (3H, d, J=5Hz), 3. 30-3. 40 (2H, m),

4, 22-4. 40 (4H, m), 4. 82 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 7. 08 (1H, brs), 7. 30 (1H, brs), 7. 52 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 551. 2 (MH⁺)

実施例 942

- 5 2-[8-第 3 ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ [1,4]オキサジン-4-イル)-2-メチル-プロパン酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 30-1. 40 (12H, m), 1. 48 (6H, s), 2. 77 (3H, d, J=5Hz), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 22-4. 33 (4H, m), 4. 85 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 08 (1H, brs), 7. 29 (1H, brs), 7. 98 (1H, s), 8. 54 (1H, q, J=5Hz), 9. 45 (1H, brs), 9. 91 (1H, brs).
- 10

実施例 943

- 15 酢酸 2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 33 (3H, s), 2. 65 (6H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 7. 66 (1H, s), 8. 19-8. 21 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 17 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).
- 20 MS:m/e (ESI) 509. 2 (MH⁺)

実施例 944

- 25 2-[2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキシ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル]-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s) 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz) 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz) 3. 82 (3H, s), 3. 93 (2H, t, J=7. 6

Hz), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.54 (2H, t, J=7.6Hz), 4.85 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.54 (1H, s), 7.83 (1H, d, J=2.0Hz), 7.99 (1H, d, J=2.0Hz), 8.20 (1H, q, J=4.4Hz), 8.56 (1H, s).

実施例 945

5 酢酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.34 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 2.37 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.81 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.31-7.34 (2H, m), 7.93 (1H, d, J=8.4Hz), 7.96 (1H, s), 9.02 (1H, brs), 9.30 (1H, brs).

10 MS:m/e (ESI) 471.1 (MH⁺)

実施例 946

酢酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.35 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.37 (3H, s), 2.83 (3H, d, J=4.4Hz), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.86 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.33 (1H, d, J=8.4Hz), 7.54 (1H, s), 7.94 (1H, d, J=8.4Hz), 7.97 (1H, s), 8.19-8.21 (1H, m), 8.56 (1H, s), 9.20 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 466.2 (MH⁺)

実施例 947

20 [8-第3ブチル-6-[2-5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イルメトキシ]-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.35 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.91 (3H, s), 3.10-3.48 (2H, m), 3.74 (2H, d, J=4.8Hz), 4.02-4.18 (2H, m), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.37-4.48 (1H, m), 4.78 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.18 (1H, s), 7.28 (1H, s), 7.32 (1H

, s), 9.04 (1H, brs), 9.33 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 572.2 (MH⁺)

実施例 948

5 8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-4-メトキシ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキ
サジン-2-イルメトキシ]-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.20 (3H, t, J=6.8Hz), 1.27 (3H, t, J=6.8Hz), 1.35 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.91
(3H, s), 3.11-3.45 (2H, m), 3.75 (2H, d, J=4.8Hz), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.10-4.25 (6
10 H, m), 4.38-4.48 (1H, m), 4.78 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.18 (1H, s), 7.28 (1H, s), 7.32 (1H
, s), 9.04 (1H, brs), 9.36 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 600.2 (MH⁺)

実施例 949

15 2-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(4-オキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.48-2.62 (4H, m), 2.81 (3H, d, J=4.0Hz), 3.22-3.
42 (4H, m), 4.03 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.54 (1H, s),
20 7.57 (1H, s), 7.63 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.0Hz), 8.55 (1H, s).

実施例 950

25 1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-オン;臭
化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.48-2.62 (4H, m), 3.28-3.

45 (4H, m), 4.02 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.33 (2H, s), 7.56 (2H, s), 7.62 (2H, s).

実施例 951

5 2-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキシ-ピロリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.12-2.24 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.0Hz), 3.28-3.40 (2H, m), 3.64-3.72 (2H, m), 3.74 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.85 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.54 (1H, s), 7.81 (1H, d, J=2.0Hz), 7.83 (1H, d, J=2.0Hz), 8.20 (1H, q, J=4.0Hz), 8.55 (1H, s).

実施例 952

15 1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-2-オン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.12-2.24 (2H, m), 3.30-3.40 (2H, m), 3.68 (2H, t, J=6.8Hz), 3.74 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.80 (1H, s), 7.81 (1H, s).

20 実施例 953

3-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-オキサゾリジン-2-オン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 3.82 (3H, s), 3.91 (2H, t, J=5.2Hz), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.54 (2H, t, J=5.2Hz), 4.80 (2H,

s), 5.45 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.82 (H, d, J=2.0Hz), 7.97 (1H, d, J=2.0).

実施例 954

2-[2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.58-1.73 (2H, m), 1.93-2.09 (2H, m), 2.69-2.81 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 3.13-3.45 (6H and H₂O, m), 3.93 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.83 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.52 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.58 (1H, s), 8.09-8.31 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.14 (1H, brs), 9.83 (1H, brs).

実施例 955

1-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.36 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.58-1.73 (2H, m), 1.95-2.08 (2H, m), 2.68-2.81 (2H, m), 3.10-3.50 (6H and H₂O, m), 3.93 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.78 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.57 (1H, s), 8.96-9.34 (2H, m).

実施例 956

2-[2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 1.59-1.71 (2H, m), 1.95-2.06 (2H, m), 2.70-2.82 (5H, m), 2.91 (6H, s), 3.16-3.42 (6H and H₂O, m), 3.93 (3H, s), 4.73 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.51 (1H,

s), 7.58 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.30-8.45 (1H, m), 8.85-8.93 (1H, m), 9.48-9.57 (1H, m)

実施例 957

5 6-[2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.28-1.47 (12H, m), 1.59-1.72 (2H, m), 1.95-2.07 (2H, m), 2.70-2.84 (5H, m), 3.13-3.52 (6H and H₂O, m), 3.94 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=6.8 Hz), 4.87 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.51 (1H, s), 7.58 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.47-8.60 (1H, m), 9.31-9.44 (1H, m), 9.88-10.02 (1H, m).

実施例 958

15 1-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 1.59-1.76 (2H, m), 1.95-2.12 (2H, m), 2.68-2.85 (2H, m), 3.15-3.50 (6H and H₂O, m), 3.86 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.80 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.57 (1H, s), 9.00-9.36 (2H, m).

実施例 959

20 2-[2-[3-第 3 ブチル-5-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.36 (9H, s), 1.87-2.13 (4H, m), 2.77 (3H, d, J=4.4 Hz), 2.85-3.00 (5H, m), 3.02-3.17 (3H, m), 3.93 (3H, s), 4.73 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.52 (1H, s), 7.60 (1H, s),

8. 06 (1H, s), 8. 30-8. 45 (1H, m), 8. 80-9. 00 (1H, m), 9. 44-9. 62 (1H, m).

実施例 960

6-[2-[3-第 3 ブチル-5-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28-1. 45 (12H, m), 1. 87-2. 14 (4H, m), 2. 78 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 85-2. 97 (2H, m), 3. 02-3. 17 (3H, m), 3. 93 (3H, s), 4. 24 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 60 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 46-8. 58 (1H, m), 9. 32-9. 42 (1H, m), 9. 88-10. 02 (1H, m).

10 実施例 961

(1-(3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル)-ピペリジン-4-イル)-1-酢酸; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 39-1. 50 (2H, m), 1. 72-1. 90 (3H, m), 2. 23 (2H, d, J=6. 4Hz), 2. 52-2. 68 (2H, m), 3. 93 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 9. 04 (1H, brs), 9. 27 (1H, brs), 12. 09 (1H, brs).

実施例 962

20 1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 75 (6H, s), 3. 82 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 4. 20 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 45 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 53 (1H, d, J=2. 0Hz).

MS: m/e (ESI) 472. 2 (MH⁺)

実施例 963

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 44 (9H, s), 2. 78-2. 92 (3H, m), 3. 59 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6. 8 Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 92-8. 08 (2H, m), 8. 21 (1H, s), 8. 40 (1H, s), 8. 56 (1H, s), 9. 19 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

10 実施例 964

1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 45 (9H, s), 3. 59 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 38 (1H, s), 7. 96-8. 05 (3H, m), 8. 38 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 498. 1 (MH⁺)

実施例 965

1-[3-第 3 ブチル-5-(エチルメチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 01 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 74 (3H, s), 3. 13 (2H, q, J=7. 2Hz), 3. 83 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 47 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 53 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 02 (1H, brs), 9. 27 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 500. 2 (MH⁺)

実施例 966

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキ
ソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン

5 酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 01 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 74 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 13 (2H, q, J=7. 0Hz), 3. 83 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 48 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54-7. 55 (2H, m), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 14 (1H, brs), 9. 81 (1H, brs).

10

MS:m/e (ESI) 495. 2 (MH⁺)

実施例 967

3-{8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イ
ル}-プロピオニトリル;臭化水素酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7Hz), 2. 80 (2H, t, J=8Hz), 3. 47 (2H, m), 3. 70 (2H, t, J=8Hz), 4. 11 (2H, q, J=7Hz), 4. 20-4. 27 (4H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 25 (2H, m), 7. 33 (1H, brs), 9. 05 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

20

MS:m/e (ESI) 523. 0 (MH⁺)

実施例 968

1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-オキサゾール-5-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエト
キシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭
化水素酸塩

25

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 45 (9H, s), 3. 59 (3H, s), 4. 10 (2H, q, J=

6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 94-8. 05 (3H, m), 8. 38 (1H, m), 9. 07 (1H, m), 9. 30 (1H, m).

実施例 969

5 1-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フル
オロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノ
ン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 01 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 74 (3H, s), 3. 13 (2H, q, J=7. 0Hz), 3. 83 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 47 (1H, d, J=2. 0Hz)
10 , 7. 54 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 07 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 472. 2 (MH⁺)

実施例 970

15 1-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(2-シク
ロプロビル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 01 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 08-1. 10 (4H, m), 1. 37 (9H, s), 2. 32 (1H, m), 2. 74 (3H, s), 3. 13 (2H, q, J=7. 0Hz), 3. 83 (3H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 48 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=7. 8Hz), 8. 09 (1H, d, J=7. 8Hz), 9. 43 (1H, brs), 9. 62 (1H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 435. 1 (MH⁺)

実施例 971

1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエトキ
シ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化
水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 45 (9H, s), 3. 59 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=

6. 8Hz), 4. 20 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 94-8. 04 (3H, m), 8. 38 (1H, s), 9. 08 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 526. 2 (MH⁺)

実施例 972

- 5 6-[2-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシフェニル]-2-オキ
ソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-
カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 01 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 34-1. 37 (12H, m), 2. 74 (3H, s), 2. 78 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 13 (2
10 H, q, J=7. 0Hz), 3. 83 (3H, s), 4. 24 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 47 (1H
, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 99 (1H, s), 8. 53 (1H, q, J=4. 8Hz), 9. 40 (1H, brs
) , 9. 92 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 496. 2 (MH⁺)

実施例 973

- 15 メタン磺酸 2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-
メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニ
ル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35-1. 54 (15H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 69 (3H, s), 4. 15-4. 40 (4H, m), 4. 86 (2H, s
20), 5. 52 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 61 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 8. 13-8. 28 (1H, m), 8. 56 (1H, s
, 9. 21 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

実施例 974

- 25 メタン磺酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシフェニル エス
テル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.35-1.50 (15H, m), 3.68 (3H, s), 4.11 (3H, t, J=6.8Hz), 4.15-4.40 (4H, m), 4.81 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.60 (1H, s), 7.62 (1H, s), 8.92-9.43 (2H, m).

実施例 975

- 5 メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (3H, t, J=6.8Hz), 1.44 (9H, s), 3.69 (3H, s), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.82 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.37 (1H, s), 7.60 (1H, s), 7.63 (1H, s), 9.00-9.40 (2H, m).

実施例 976

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(エチルメチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル 1}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.01 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 2.74 (3H, s), 2.77 (3H, d, J=5.0Hz), 2.91 (6H, s), 3.12 (2H, q, J=7.0Hz), 3.83 (3H, s), 4.73- (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.47 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.37 (1H, q, J=5.0Hz), 8.92 (1H, brs), 9.51 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 494.2 (MH⁺)

- 20 実施例 977

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 0.98 (6H, t, J=7.2Hz), 1.37 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.83 (3H, d, J=4.8Hz), 3.16 (4H, q, J=7.2Hz), 3.86 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.84 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.50 (

^1H , d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.54 (1H, s), 7.55 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 8.21 (1H, q, $J=4.8\text{Hz}$), 8.56 (1H, s), 9.07 (1H, brs), 9.80 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 509.2 (MH^+)

実施例 978

- 5 1-(3-第3ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

^1H -NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ :

- 10 0.98 (6H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 1.29 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 3.16 (4H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 3.86 (3H, s), 4.12 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 4.21 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 4.79 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.48 (1H, d, $J=1.6\text{Hz}$), 7.54 (1H, d, $J=1.6\text{Hz}$), 9.02 (1H, brs), 9.28 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 514.2 (MH^+)

実施例 979

- 15 1-(3-第3ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

^1H -NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ :

- 20 0.98 (6H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 1.37 (9H, s), 3.16 (4H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 3.86 (3H, s), 3.87 (3H, s), 3.96 (3H, s), 4.81 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.37 (1H, s), 7.49 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.54 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 9.06 (1H, brs), 9.30 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 486.2 (MH^+)

実施例 980

- 25 (1-(3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル)-ピペリジン-4-イル)-酢酸 エチル エステル; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 18 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 39
-1. 56 (2H, m), 1. 73-1. 92 (3H, m), 2. 30 (2H, d, J=6. 4Hz), 2. 52-2. 68 (2H, m), 3. 92 (3H, s
) , 4. 00-4. 15 (4H, m), 4. 20 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7.
50 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 8. 90-9. 35 (2H, m).

5

MS:m/e (ESI) 612. 3 (MH⁺)

実施例 981

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ
-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェニル

10

エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 44 (9H, s), 2. 67 (6H, s), 3. 73 (3H, s), 4
. 12 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7.
67 (1H, s), 7. 75 (1H, s).

15

MS:m/e (ESI) 550. 1 (MH⁺)

実施例 982

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミ
ノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル
エステル;臭化水素酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 44 (9H, s), 2. 67 (6H, s), 3. 73 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 51 (2
H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 75 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 522. 1 (MH⁺)

実施例 983

25

6-[2-(3-第3ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチ
ル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン

酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.98(6H, t, J=7.0Hz), 1.34-1.37 (12H, m), 2.78(3H, d, J=4.4Hz), 3.16(4H, q, J=7.0Hz), 3.86(3H, s), 4.24(2H, q, J=7.0Hz), 4.88(2H, s), 5.52(2H, s), 7.49(1H, s), 7.55(1H, s), 8.00(1H, s), 8.53(1H, q, J=4.4Hz), 9.39(1H, brs), 9.94(1H, brs).

MS: m/e (ESI) 510.2 (MH⁺)

実施例 984

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.31-1.43(15H, m), 2.75(6H, s), 2.83(3H, d, J=4.6Hz), 4.13(2H, q, J=7.0Hz), 4.28(2H, q, J=7.0Hz), 4.84(2H, s), 5.49(2H, s), 7.45(1H, s), 7.54(1H, s), 7.56(1H, s), 8.21(1H, q, J=4.6Hz), 8.55(1H, s), 9.13(1H, brs), 9.81(1H, brs).

MS: m/e (ESI) 495.2 (MH⁺)

実施例 985

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36(9H, s), 1.41(3H, t, J=6.8Hz), 1.54-1.67(2H, m), 1.84-1.96(2H, m), 2.66-2.76(2H, m), 2.82(3H, d, J=4.8Hz), 3.18-3.36(2H, m), 3.52-3.68(1H, m), 3.94(3H, s), 4.27(2H, q, J=6.8Hz), 4.73(1H, d, J=4.0Hz), 4.84(2H, s), 5.49(2H, s), 7.52(1H, s), 7.54(1H, s), 7.58(1H, s), 8.12-8.25(1H, m), 8.55(1H, s), 9.14(1H, brs), 9.83(1H, brs).

実施例 986

1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

ル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 29 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 54-1. 68 (2H, m), 1. 84-1. 96 (2H, m), 2. 65-2. 78 (2H, m), 3. 17-3. 42 (2H, m), 3. 58-3. 67 (1H, m), 3. 94 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 73 (1H, d, J=3.2Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 95-9. 11 (1H, m), 9. 18-9. 36 (1H, brs).

実施例 987

10 6-[2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ビペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピ
リジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 26-1. 50 (12H, m), 1. 50-1. 68 (2H, m), 1. 84-2. 03 (2H, m), 2. 64-2. 86 (5H, m), 3. 12-3. 68 (3H, m), 3. 94 (3H, s), 4. 23 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 44-7. 70 (2H, m), 7. 99 (1H, s), 8. 41-8. 63 (1H, m), 9. 37 (1H, brs), 9. 94 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 538. 3 (MH⁺)

実施例 988

20 1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ビペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 36 (9H, s), 1. 54-1. 70 (2H, m), 1. 84-2. 00 (2H, m), 2. 65-2. 80 (2H, m), 3. 19-3. 50 (2H, m), 3. 55-3. 70 (1H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 93 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 73 (1H, d, J=4.0Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 99-9. 40 (2H, m).

実施例 989

1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ビペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ

ル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.00-1.19 (4H, m), 1.36 (9H, s), 1.54-1.68 (2H, m), 1.84-1.96 (2H, m), 2.24-2.37 (1H, m), 2.64-2.78 (2H, m), 3.18-3.46 (2H, m), 3.53-3.70 (1H, m), 3.94 (3H, s), 4.73 (1H, d, J=4.0Hz), 4.82 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.52 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.73 (1H, d, J=8.0Hz), 8.10 (1H, d, J=8.0Hz), 9.50-9.76 (2H, m).

MS:m/e (ESI) 477.2 (MH⁺)

実施例 990

- 10 メタン磺酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.08-1.10 (4H, m), 1.45 (9H, s), 2.30-2.33 (1H, m), 2.67 (6H, s), 3.73 (3H, s), 4.83 (2H, s), 5.80 (2H, s), 7.68 (1H, s), 7.72 (1H, d, J=7.8Hz), 7.53 (1H, s), 8.10 (1H, d, J=7.8Hz).

MS:m/e (ESI) 485.1 (MH⁺)

実施例 991

- 20 1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.34-1.41 (15H, m), 2.75 (6H, s), 4.08-4.16 (4H, m), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.78 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.44 (1H, s), 7.54 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 500.2 (MH⁺)

実施例 992

1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシフェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 36(3H, t, J=7.0Hz), 1.38(9H, s), 2.75(6H, s), 3.87(3H, s), 3.95(3H, s), 4.13(2H, q, J=7.0Hz), 4.79(2H, s), 5.48(2H, s), 7.36(1H, s), 7.44(1H, d, J=1.6Hz), 7.54(1H, d, J=1.6Hz).

MS:m/e(ESI)472.2(MH⁺)

実施例 993

- 10 1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 15 1.29(3H, t, J=7.0Hz), 1.38-1.41(12H, m), 2.61(6H, s), 4.11(2H, q, J=7.0Hz), 4.21(2H, q, J=7.0Hz), 4.78(2H, s), 5.44(2H, s), 7.33(1H, s), 7.63(1H, s), 7.68(1H, s), 9.01(1H, brs), 9.26(1H, brs).

MS:m/e(ESI)472.2(MH⁺)

実施例 994

- 20 2-[2-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 25 1.37(3H, t, J=7.0Hz), 1.38(9H, s), 2.75(6H, s), 2.78(3H, d, J=4.6Hz), 2.91(6H, s), 4.13(2H, q, J=7.0Hz), 4.73(2H, s), 5.43(2H, s), 7.15(1H, s), 7.45(1H, s), 7.55(1H, s), 8.06(1H, s), 8.37(1H, q, J=4.6Hz).

MS:m/e(ESI)494.2(MH⁺)

実施例 995

6-[2-(3-第 3 ブチル-5 ジメチルアミノ-4-エトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 34-1. 39 (15H, m), 2. 75 (6H, s), 2. 78 (3H, d, $J=4.6\text{ Hz}$), 4. 13 (2H, q, $J=7.0\text{ Hz}$), 4. 24 (2H, q, $J=7.0\text{ Hz}$), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 45 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 53 (1H, q, $J=4.6\text{ Hz}$), 8. 55 (1H, s), 9. 39 (1H, brs), 9. 92 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 496. 2 (MH $^+$)

10 実施例 996

メタン磺フオン酸 2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1. 44 (9H, s), 2. 67 (6H, s), 2. 78 (3H, d, $J=4.8\text{ Hz}$), 2. 92 (6H, s), 3. 72 (3H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 16 (1H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 75 (1H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 37 (1H, q, $J=4.8\text{ Hz}$).

MS: m/e (ESI) 544. 2 (MH $^+$)

実施例 997

20 1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシフェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1. 08-1. 10 (4H, m), 1. 37 (3H, t, $J=7.0\text{ Hz}$), 1. 39 (9H, s), 2. 75 (6H, s), 4. 13 (2H, q, $J=7.0\text{ Hz}$), 4. 81 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 45 (1H, d, $J=2.0\text{ Hz}$), 7. 55 (1H, d, $J=2.0\text{ Hz}$), 7. 72 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 8. 09 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$).

MS:m/e (ESI) 435. 2 (MH⁺)

実施例 998

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;トリフルオロ酢酸塩

5

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 45 (9H, s), 2. 67 (6H, s), 2. 78 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 24 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 75 (1H, s), 8. 01 (1H, s), 8. 53 (1H, q, J=4. 8Hz), 9. 43 (1H, brs), 9. 98 (1H, brs).

10 MS:m/e (ESI) 546. 1 (MH⁺)

実施例 999

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 08-1. 10 (4H, m), 1. 40-1. 44 (12H, m), 2. 31-2. 34 (1H, m), 3. 69 (3H, s), 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 59 (2H, s), 7. 61 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 7. 73 (1H, d, J=8. 2Hz), 8. 11 (1H, d, J=8. 2Hz), 9. 50 (1H, brs), 9. 68 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 486. 1 (MH⁺)

20 実施例 1000

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 40-1. 44 (12H, m), 2. 78 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 69 (3H, s), 4. 26 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 74 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 16 (1H, s), 7. 61 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 8. 06 (1H, s), 8

. 38 (1H, q, J=4. 4Hz).

MS:m/e (ESI) 545. 2 (MH⁺)

実施例 1001

5 1-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 98 (6H, t, J=7. 0Hz), 1. 06-1. 10 (4H, m), 1. 37 (9H, s), 2. 29-2. 34 (1H, m), 3. 15-3. 19 (4H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 86 (3H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 55 (1H, s),
10 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 11 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 30 (1H, brs), 9. 62 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 449. 2 (MH⁺)

実施例 1002

15 2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 98 (6H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 78 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 92 (6H, s), 3. 16 (4H, q, J=7. 0Hz), 3. 85 (3H, s), 4. 74 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 49 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 55 (1H, s), 7. 55 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 07 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 92 (1H, brs), 9
20 . 53 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 508. 2 (MH⁺)

実施例 1003

25 メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.40-1.44 (12H, m), 2.78 (3H, d, J=4.4 Hz), 3.69 (3H, s), 4.21-4.29 (4H, m), 4.90 (2H, s), 5.57 (2H, s), 7.60 (1H, s), 7.63 (1H, s), 8.00 (1H, s), 8.53 (1H, q, J=4.4 Hz), 9.43 (1H, brs), 9.98 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 547.1 (MH⁺)

5 実施例 1004

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-メチルアミノ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1.29 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0 Hz), 2.76 (3H, d, J=5.2 Hz), 3.72 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.79 (2H, s), 5.46 (2H, s), 5.50 (1H, q, J=5.2 Hz), 7.04 (1H, s), 7.23 (1H, s), 7.33 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 472.1 (MH⁺)

実施例 1005

15 1-[3-第3ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル);臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.36 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8 Hz), 1.54-1.68 (2H, m), 1.83-1.96 (2H, m), 2.64-2.78 (2H, m), 3.21-3.48 (2H, m), 3.58-3.69 (1H, m), 3.87 (3H, s), 3.94 (3H, s), 4.22 (2H, q, J=6.8 Hz), 4.73 (1H, d, J=4.0 Hz), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.56 (1H, s), 9.00-9.12 (1H, m), 9.20-9.34 (1H, m).

MS: m/e (ESI) 528.2 (MH⁺)

実施例 1006

25 メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェニル エス

テル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 43 (9H, s), 3. 65 (3H, s), 3. 96 (3H, s), 4. 11 (3H, t, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 61 (1H, s), 7. 63 (1H, s), 8. 99-9. 41 (2H, m).

5

実施例 1007

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシフェニル エステル;臭化水素酸塩

10

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 03-1. 20 (4H, m), 1. 43 (9H, s), 2. 27-2. 37 (1H, m), 3. 66 (3H, s), 3. 97 (3H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 65 (2H, s), 7. 64 (2H, brs), 7. 72 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 11 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 52-9. 82 (2H, m).

実施例 1008

15

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェニル エステル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 55 (3H, s), 4. 00 (3H, s), 4. 30 (3H, t, J=6. 8Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 87 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 8. 17-8. 28 (1H, m), 8. 58 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

20

実施例 1009

メタンスルホン酸 3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル エステル

25

テル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 31 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 54 (3H, s), 4. 00 (3H, s), 4. 13 (3H, t, J=6. 8Hz), 4. 23 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 86 (1H, s), 7. 90 (1H, s), 9. 01-9. 16 (1H, m), 9. 28-9. 43 (1H, m).

実施例 1010

5 2-(2-[3-第 3 プチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 41 (9H, s), 1. 54-1. 70 (2H, m), 1. 84-1. 98 (2H, m), 2. 64-2. 84 (5H, m), 2. 91 (6H, s), 3. 19-3. 46 (2H, m), 3. 54-3. 72 (1H, m), 3. 93 (3H, s), 4. 52-4. 58 (3H, m), 5. 45 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 31-8. 50 (1H, m), 8. 80-9. 05 (1H, m), 9. 40-9. 65 (1H, m).

実施例 1011

15 2-(2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 41 (3H, t, J=7Hz), 1. 68 (3H, s), 1. 74 (3H, s), 2. 77 (6H, s), 2. 82 (3H, d, J=5Hz), 3. 83 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 51 (1H, brs), 7. 54 (1H, brs), 7. 66 (1H, brs), 8. 21 (1H, m), 8. 56 (1H, brs), 9. 21 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 484. 4 (MH⁺)

実施例 1012

25 6-(2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル)-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=7Hz), 1. 68 (3H, s), 1. 74 (3H, s), 2. 78 (9H, m), 2. 82 (3H, d, J=5Hz), 3. 84 (3H, s), 4. 24 (2H, q, J=7Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 50 (1H, brs), 7. 66 (1H, brs), 8. 00 (1H, s), 8. 54 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 485. 3 (MH⁺)

5 実施例 1013

2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インズドール-2-イル)-1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシフェニル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 29 (3H, t, J=7Hz), 1. 40 (3H, t, J=7Hz), 1. 68 (3H, s), 1. 74 (3H, s), 2. 77 (6H, s), 3. 83 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7Hz), 4. 21 (2H, q, J=7Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 34 (1H, brs), 7. 50 (1H, brs), 7. 65 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 490. 4 (MH⁺)

実施例 1014

15 2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシフェニル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 02-1. 13 (4H, m), 1. 68 (3H, s), 1. 74 (3H, s), 2. 31 (1H, m), 2. 77 (6H, s), 3. 83 (3H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 51 (1H, brs), 7. 66 (1H, brs), 7. 72 (1H, d, J=8Hz), 8. 10 (1H, d, J=8Hz), 9. 48 (1H, brs), 9. 67 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 425. 3 (MH⁺)

実施例 1015

25 6-ジメチルアミノ-2-(2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル)-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インズドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 67 (3H, s), 1. 73 (3H, s), 2. 77 (9H, m), 2. 92 (6H, s), 3. 83 (3H, s), 4. 74 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 50 (1H, d, J=2Hz), 7. 66 (1H, d, J=2Hz), 8. 07 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=5Hz), 8. 94 (1H, brs), 9. 55 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 484. 4 (MH⁺)

実施例 1016

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 45 (9H, s), 2. 67 (6H, s), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 73 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 76 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, s).

実施例 1017

15 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[1,3]オキサジナン-3-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 32 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 56-1. 68 (2H, m), 3. 42-3. 48 (2H, m), 3. 89 (3H, s), 3. 80-3. 92 (2H, m), 4. 13 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 23 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 36 (2H, s), 7. 60 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 77 (1H, d, J=2. 0Hz).

MS:m/e (ESI) 528. 2 (MH⁺)

実施例 1018

25 2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン

ドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 39 (9H, s), 1. 80-1. 92 (1H, m), 1. 98-2. 11 (1H, m), 2. 74-2. 84 (4H, m) 2. 94 (6H, s), 3. 0
8-3. 18 (1H, m), 3. 26-3. 50 (2H, m), 3. 65 (3H, s), 4. 32-4. 47 (1H, m), 4. 75 (2H, s), 4. 64-
5. 01 (1H, m), 5. 47 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 8. 09 (1H, s), 8. 30-8
. 54 (1H, m), 8. 94 (1H, brs), 9. 55 (1H, brs).

実施例 1019

1-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドル-2-
イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩
1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 79-1. 92 (1H, m), 1. 98-2. 12 (1H, m), 2. 90-2. 99 (1H, m), 3. 08-3. 18 (1H,
m), 3. 20-3. 60 (2H, m), 3. 65 (3H, s), 3. 89 (3H, s), 3. 97 (3H, s), 4. 30-4. 43 (1H, m), 4. 81
(2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 43 (1H, s), 9. 08 (1H, brs), 9. 31 (1H,
brs).

実施例 1020

2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドル-2-イ
ル)-1-[3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェ
ニル]-エタノン;臭化水素酸塩
1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 21 (6H, d, J=7. 2Hz), 1. 31 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 54-1. 68 (2H, m)
, 1. 86-1. 96 (2H, m), 2. 70-2. 82 (2H, m), 3. 20-3. 68 (3H, m), 3. 88 (3H, s), 4. 13 (2H, q, J=
7. 2Hz), 4. 23 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 74 (1H, d, J=4. 0Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 35 (1H, s),
7. 43 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 98-9. 12 (1H, m), 9. 20-9. 38 (1H, m).

MS: m/e (ESI) 528. 4 (MH⁺)

実施例 1021

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 20 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7.0Hz), 2. 82 (3H, d, J=4.8Hz), 3. 12-3. 17 (2H, m), 3. 73 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 29 (1H, t, J=6.0Hz), 5. 46 (2H, s), 7. 11 (1H, s), 7. 23 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=4.8Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 18 (1H, brs), 9. 80 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 481. 3 (MH⁺)

10 実施例 1022

1-(3-第 3 ブチル-5-エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 20 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 29 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7.0Hz), 3. 12-3. 19 (2H, m), 3. 72 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 29 (1H, t, J=6.0Hz), 5. 45 (2H, s), 7. 10 (1H, s), 7. 22 (1H, s), 7. 33 (1H, s), 9. 03 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 486. 3 (MH⁺)

20 実施例 1023

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 20 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 78 (3H, d, J=4.6Hz), 2. 92 (6H, s), 3. 12-3. 19 (2H, m), 3. 72 (3H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 28 (1H, t, J=5.8Hz), 5. 42 (2H, s), 7. 10 (1H, s), 7. 15 (

¹H, s), 7.23 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.37 (1H, q, J=4.6 Hz), 8.92 (1H, brs), 9.52 (1H, brs)

MS:m/e (ESI) 480.3 (MH⁺)

実施例 1024

- 5 1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシフェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.39 (9H, s), 2.61 (6H, s), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.80 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.63 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.68 (1H, d, J=2.0 Hz).

MS:m/e (ESI) 444.2 (MH⁺)

実施例 1025

- 15 6-[2-(3-第3ブチル-5-エチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.34-1.37 (12H, m), 2.78 (3H, d, J=5.0 Hz), 3.12-3.18 (2H, m), 3.73 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.87 (2H, s), 5.29 (1H, t, J=6.0 Hz), 5.49 (2H, s), 7.10 (1H, s), 7.23 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.52 (1H, q, J=5.0 Hz).

- 20 MS:m/e (ESI) 482.3 (MH⁺)

実施例 1026

- 25 2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-メチルアミノフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.36 (9H, s), 2.75-2.78 (6H, m), 2.91 (6H, s), 3.72 (3H, s), 4.71 (2H, s), 5.40 (2H, s), 5

. 49 (1H, q, J=4. 8Hz), 7. 05 (1H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 24 (1H, s), 8. 05 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=4. 8Hz).

MS: m/e (ESI) 466. 3 (MH⁺)

実施例 1027

- 5 2-[2-[3-第 3 プチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 79-1. 92 (1H, m), 1. 98-2. 12 (1H, m), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 92-2. 99 (1H, m), 3. 08-3. 18 (1H, m), 3. 20-3. 65 (2H, m), 3. 66 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 35-4. 45 (1H, m), 4. 86 (2H, s), 5. 43-5. 58 (2H, m), 7. 36 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 16-8. 30 (1H, m), 8. 58 (1H, s), 9. 17 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

実施例 1028

- 15 6-[2-(3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-メチルアミノ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34-1. 38 (12H, m), 2. 75-2. 78 (6H, m), 3. 72 (3H, s), 4. 24 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 05 (1H, s), 7. 24 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 52 (1H, q, J=5. 2Hz).

- 20 MS: m/e (ESI) 468. 3 (MH⁺)

実施例 1029

- 25 (1-[5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-イソプロピル-2-メトキシ-フェニル]-ピペリジン-4-イル)-酢酸; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 19 (6H, d, J=7. 2Hz), 1. 32-1. 48 (5H, m), 1. 70-1. 87 (3H, m), 2. 16-2. 26 (2H, m), 2. 54-

2. 68 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=3. 6Hz), 3. 85 (3H, s), 4. 27 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 41 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 13-8. 24 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 565. 3 (MH⁺)

5 実施例 1030

1-(5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-イソプロピル-2-メトキシ-フェニル)-ピペリジン-4-イル)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 19 (6H, d, J=6. 8Hz), 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 33-1. 48 (5H, m), 1. 72-1. 86 (3H, m), 2. 18-2. 25 (2H, m), 2. 54-2. 66 (2H, m), 3. 85 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 99-9. 08 (1H, m), 9. 24-9. 36 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 570. 4 (MH⁺)

15 実施例 1031

1-(3-第 3 ブチル-5-エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 20 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 3. 12-3. 19 (2H, m), 3. 73 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 4. 79 (2H, s), 5. 29 (1H, t, J=6. 0Hz), 5. 45 (2H, s), 7. 10 (1H, s), 7. 23 (1H, s), 7. 36 (1H, s), 9. 00 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 458. 2 (MH⁺)

実施例 1032

- 25 1-(3-第 3 ブチル-5 エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸

塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 08-1. 10 (4H, m), 1. 20 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 26-2. 35 (1H, m), 3. 12-3. 18 (2H, m), 3. 73 (3H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 29 (1H, t, J=6. 0Hz), 5. 54 (2H, s), 7. 11 (1H, s), 7. 23 (1H, s), 7. 71 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz).

MS:m/e (ESI) 421. 2 (MH⁺)

実施例 1033

1-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 36-1. 41 (15H, m), 4. 08-4. 15 (4H, m), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 9. 00 (1H, brs), 9. 30 (1H, brs), 9. 44 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 473. 2 (MH⁺)

実施例 1034

2-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36-1. 43 (15H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 6Hz), 4. 12 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 43 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 6Hz), 8. 55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 468. 2 (MH⁺)

実施例 1035

エチル-カルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミ

ノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.08 (3H, t, J=7.0Hz), 1.27-1.33 (15H, m), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 3.06-3.14 (2H, m), 4.03-4.14 (4H, m), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.80 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.86 (1H, t, J=4.8Hz), 9.02 (1H, brs), 9.33 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 544.3 (MH⁺)

実施例 1036

- 10 エチル-カルバミン酸 2-第3ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.09 (3H, t, J=7.0Hz), 1.31 (3H, t, J=7.0Hz), 1.34 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.05-3.11 (2H, m), 4.07 (2H, q, J=7.0Hz), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.52 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.86 (1H, t, J=6.0Hz), 8.21 (1H, q, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 539.4 (MH⁺)

実施例 1037

- 20 メタンスルホン酸 2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 1.44 (9H, s), 2.10-2.17 (2H, m), 2.69 (2H, t, J=7.2Hz), 3.67 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.82 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.63 (1H, s), 7.66 (1H, s), 9.08 (1H, brs), 9.32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 590.2 (MH⁺)

実施例 1038

1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロペニル-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

- 5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :
 2.09 (3H, s), 2.80 (6H, s), 3.72 (3H, s), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.81 (2H, s), 5.04 (1H, m), 5.23 (1H, m), 5.49 (2H, s), 7.37 (1H, brs), 7.40-7.42 (2H, m).
 MS: m/e (ESI) 442.3 (MH⁺)

実施例 1039

- 10 メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-(3-シアノプロポキシ)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル; 臭化水素酸塩

- $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :
 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 1.44 (9H, s), 2.11-2.17 (2H, m), 2.69 (2H, t, J=7.2Hz), 2.83 (3H, d, J=4.8Hz), 3.67 (3H, s), 4.25-4.30 (4H, m), 4.86 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.55 (1H, s), 7.64 (1H, s), 7.67 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=4.8Hz), 8.56 (1H, s), 9.20 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).
 MS: m/e (ESI) 585.3 (MH⁺)

実施例 1040

- 20 1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチル-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

- $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :
 1.18 (3H, s), 1.28 (3H, t, J=6.8Hz), 1.35 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.59-1.80 (4H, m), 2.88-3.09 (4H, m), 3.93 (3H, s), 4.11 (3H, q, J=6.8Hz), 4.21 (3H, q, J=6.8Hz), 4.78 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.53 (1H, s), 7.55 (1H, s), 8.98-9.10 (1H, m), 9.20

-9.33 (1H, m).

MS: m/e (ESI) 556.4 (MH⁺)

実施例 1041

5 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピペラジン-1-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 2塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 3.21 (4H, brs), 3.32 (4H, brs), 3.94 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.64 (1H, s), 9.04-9.16 (3H, m), 9.40 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 527.3 (MH⁺)

実施例 1042

15 2-(2-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシエチル)-メチルアミノ]-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.16 (3H, t, J=6.8), 1.36 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.68-2.95 (6H, m), 3.18 (3H, s), 3.20-3.48 (4H, m), 3.81 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.46-7.60 (3H, m), 8.20 (1H, q, J=4.0Hz), 8.55 (1H, s), 9.16 (1H, brs), 9.83 (1H, s).

20 MS: m/e (ESI) 525.4 (MH⁺)

実施例 1043

25 2-(2-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシエチル)-メチルアミノ]-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 2.77 (3H, d, J=4.0Hz), 2.80 (3H, s), 2.91 (6H, s), 3.18 (3H, s), 3.20-3.48